PCT



特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(51) 国際特許分類 5

C07D 453/02, A61K 31/435 A61K 31/44, 31/535

(11) 国際公開番号

WO 93/09116

A1

(43) 国際公開日

1993年5月13日(13.05.1993)

(21)国際出願番号

5

PCT/JP92/01426

(81) 指定国

(22)国際出願日

(30) 優先権データ

特願平3/319794

1992年11月4日(04.11.92)

JР

AT(欧州特許), BE(欧州特許), CA, CH(欧州特許), DE(欧州特許), DK(欧州特許), ES(欧州特許), FR(欧州特許),

GB(欧州特許), GR(欧州特許), HU, IE(欧州特許),

IT(欧州特許), JP, KR, LU(欧州特許), MC(欧州特許),

NL(欧州特許), SE(欧州特許), US.

(71) 出願人(米国を除くすべての指定国について)

吉富製薬株式会社

(YOSHITOMI PHARMACEUTICAL INDUSTRIES, LTD.) [JP/JP]

1991年11月7日(07.11.91)

〒541 大阪府大阪市中央区平野町二丁目6番9号 Osaka, (JP)

(72) 発明者; および

(75)発明者/出願人(米国についてのみ)

村上 修(MURAKAMI, Shu)[JP/JP]

北嶋 浩(KITAJIMA, Hiroshi)[JP/JP]

應子嶋正彦(KAGOSHIMA, Masahiko)[JP/JP]

安松 浩(YASUMATSU, Hiroshi)[JP/JP]

〒871 福岡県築上郡吉富町大字小祝955番地

吉富製薬株式会社 中央研究所内 Fukuoka, (JP)

(74) 代理人

弁理士 高島 一(TAKASHIMA, Hajime)

〒541 大阪府大阪市中央区平野町三丁目3番9号 湯木ビル

Osaka, (JP)

添付公開書類

国際調査報告書

補正書

(54) Title: QUINUCLIDINE COMPOUND AND MEDICINAL USE THEREOF

(54) 発明の名称 キヌクリジン化合物およびその医薬用途

$$R^{1} \xrightarrow{A} X$$

$$R^{2}$$

$$R^{4} \xrightarrow{NH} R^{6}$$

$$R^{8}$$

$$(1)$$

(57) Abstract

A quinuclidine compound represented by general formula (I) and a pharmaceutically acceptable acid addition salt thereof, wherein each symbol is as defined in the specification. Because they have a P substance antagonism, they are useful for treating pains such as migraine, inflammations, respiratory system diseases such as chronic bronchitis accompanied with cough, sputum, etc., asthma, or rhinitis, central nervous system diseases such as anxiety or psychosis, cardiovascular system diseases such as hypertension or heart failure, and digestive system diseases such as hypersensitive colitis, ulcerous colitis or Crohn disease.

(57) 要約

一般式(I)

$$R^{1} \xrightarrow{A} X$$

$$R^{2}$$

$$R^{2}$$

$$R^{3}$$

$$R^{4} \xrightarrow{NH} R^{6}$$

(式中、各記号は明細書に定義されている通りである。)

により表されるキヌクリジン化合物またはその医薬上許容されうる酸付加塩。

本発明のキヌクリジン化合物またはその医薬上許容されうる酸付加塩は、P物質の拮抗作用を有することから、痛み(片頭痛など)、炎症、呼吸器系疾患(咳、喀痰などを伴う慢性気管支炎、喘息、鼻炎など)、中枢神経系疾患(不安症、精神病など)、循環器系疾患(高血圧症、心不全など)、消化器系疾患(過敏性大腸炎、潰瘍性大腸炎、クローン病など)の治療薬として有用である。

情報としての用途のみ

PCTに基づいて公開される国際出願のハンフレット第1頁にPCT加盟国を同定するために使用されるコード

MW マラウィ NL マラウター NO ファウィーランド NO ファーーシャル NZ エー・アンドル RO ファー・アンドル RO ルロスファー・アンドル RO ルロスファー・アンドル SD スウロガルエド SN スカヴィーゴライ SN ストヴィーゴライ TD トウタ アウロート UA アンドークロート UA アンドークロート Ž.

ď

明細書

キヌクリジン化合物およびその医薬用途

「技術分野」

本発明は、ペプチド性神経伝達物質である P物質(Substance P: Arg-Pro-Lys-Pro-Gln-Gln-Phe-Phe-Gly-Leu-Met-NH2)の拮抗作用を有することを特徴とする、痛み、炎症、呼吸器系疾患、中枢神経系疾患、消化器系疾患、循環器系疾患の治療薬として有用なキヌクリジン化合物またはその医薬上許容されうる酸付加塩およびその医薬用途に関するものである。

「背景技術」

P物質、ニューロキニンA、ニューロキニンBなどのニューロキニンと称される物質は哺乳動物において見出されるタヒキニン系ペプチドであり、とりわけP物質が痛みの伝達や、不安を惹起すること、さらには精神分裂症、呼吸器系疾患、炎症および消化器系疾患などの種々の病理学的分野に関与することはよく知られている(たとえば、ジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー(Journal of Medicinal Chemistry)Vol. 25, P.1009)。したがって、P物質に特異的な拮抗作用を有する物質は前述の疾患を治療するのに有用と考えられる。

これまでに、ペプチド性P物質拮抗剤としては、米国特許第4,559,324号 (特開昭59-21656号)、ヨーロッパ公開特許第360390号 (特開平2-124887号)、ヨーロッパ公開特許第336230号 (特開平2-204499号)、ヨーロッパ公開特許第394989号 (特開平3-27399号)などに開示されているが、経口投与での有効性は必ずしも明確ではなく、また生体内でも速やかに分解されるなどの問題点が残る。一方、非ペプチド性拮抗薬としてはWO90/05729号、米国特許第5,102,667号 (特開平3-176469号)、ヨーロッパ公開特許第428434号 (特開平3-206086号)などに開示されているが、作用の持続や安全性などの点で必ずしも満足できるものとはいい難い。

ところで、特開昭59-186969号、特開平1-168686号の各公報により、鎮吐作用などを有するベンゾフランおよびベンゾピラン化合物が知られ

3

ている。また、ヨーロッパ公開特許第407137号 (特開平3-279372号)、米国特許第4,892,872号 (特開平2-28182号)などの公報により5-HT。 拮抗作用を有し、制吐剤などとして有用なベンズオキサジン化合物が知られている。

「発明の開示」

本発明者らは、かかる問題点を解決すべく鋭意研究を行った結果、新規キヌクリジン化合物がタヒキニン類、とりわけP物質の拮抗作用を有し、さらにバイオアベイラビリティーの面で改良されていることを見出し、本発明を完成させるに至った。

すなわち、本発明は、一般式(I)

$$\begin{array}{c}
R^1 \\
 & R^2 \\
 & R^3
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
R^4 \\
 & R^6 \\
\end{array}$$

〔式中、Aはメチレン基、酸素原子、硫黄原子、-N(R7)-で表される基(式中、R7 は水素、炭素数 $1\sim 6$ 個のアルキルまたはアラルキルを示す。)または直接結合を示す。XおよびYは同一または異なって酸素原子、硫黄原子または水素 2 原子を示す。R1 は水素、ハロゲン、炭素数 $1\sim 6$ 個のアルキル、ハロアルキル、アラルキル、炭素数 $1\sim 6$ 個のアルコキシ、アラルキルオキシ、アリールオキシ、アシル、アシルオキシ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、シアノまたは式

- $-NHCOR^{s}$, $-S(O)_{n}R^{s}$, $-NHSO_{2}R^{s}$, $-COOR^{s}$,
- $-N(R^{8})(R^{9}), -CON(R^{8})(R^{9}), -O-CO-N(R^{8})(R^{9}),$
- $-O-CS-N(R^{8})(R^{9}), -SO_{2}N(R^{8})(R^{9})$

(式中、 R^8 , R^8 は同一または異なってそれぞれ水素、炭素数 $1 \sim 6$ 個のアルキル、フェニルまたはアラルキルを示し、n は 0, 1 または 2 を示す。)

ď

から選ばれる基を示す。 R^2 , R^3 は同一または異なって水素または炭素数 $1 \sim 6$ 個のアルキルを示す。 R^4 は水素または炭素数 $1 \sim 6$ 個のアルキルを示す。 R^6 は炭素数 $1 \sim 6$ 個のアルキル、炭素数 $2 \sim 6$ 個のアルケニル、炭素数 $3 \sim 7$ 個のシクロアルキル、フリル、チエニル、ピリジル、インドリル、ビフェニルまたはフェニルを示す。ただし、Aが酸素原子、X およびYが共に水素 2 原子、 R^1 が水素かつ R^2 , R^3 が共に水素である場合、X およびYが共に水素 2 原子、X が共に水素の表現の、X が共に水素の表現の、X が共に水素のある場合を除く。)

により表されるキヌクリジン化合物またはその医薬上許容されうる酸付加塩に関する。

上記定義中および本明細書において、ハロゲンとは塩素、フッ素、臭素、ヨウ素を示す。

炭素数1~6個のアルキルとは、直鎖状または分枝鎖状のアルキルを示し、た とえばメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、第3級 プチル、ペンチル、イソペンチル、ヘキシルなどが挙げられる。

ハロアルキルとは、アルキル部が炭素数 $1 \sim 6$ 個であって、たとえばクロロメチル、フルオロメチル、トリフルオロメチル、 2 , 2 , 2 ートリフルオロエチル、トリクロロメチルなどが挙げられる。

炭素数1~6個のアルコキシとは、直鎖状または分枝鎖状のアルコキシを示し、 たとえばメトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、イソブ トキシ、第3級プトキシ、ペンチルオキシ、イソペンチルオキシ、ヘキシルオキ シなどが挙げられる。

アラルキルとは、アルキル部が炭素数1~4個であるフェニルアルキルであって、ベンジル、2-フェニルエチル、1-フェニルエチル、3-フェニルプロピル、4-フェニルプチルなどが挙げられ、フェニル環上にハロゲン、ニトロ、アミノ、水酸基、トリフルオロメチル、炭素数1~6個のアルキル、炭素数1~6個のアルコキシから選ばれる1~3個の置換基を有していてもよい。

アラルキルオキシとは、アルキル部が炭素数1~4個であるフェニルアルキル

オキシであって、たとえばベンジルオキシ、2-フェニルエトキシ、3-フェニルプロポキシ、4-フェニルプトキシなどが挙げられ、フェニル環上にハロゲン、ニトロ、アミノ、水酸基、トリフルオロメチル、炭素数1~6個のアルキル、炭素数1~6個のアルコキシから選ばれる1~3個の置換基を有していてもよい。

アリールオキシとは、アリール部が複素芳香環でもよく、たとえばフェノキシ、 ピリジルオキシ、フリルオキシ、チエニルオキシなどが挙げられ、アリール部に ハロゲン、ニトロ、アミノ、水酸基、トリフルオロメチル、炭素数1~6個のア ルキル、炭素数1~6個のアルコキシから選ばれる1~3個の置換基を有してい てもよい。

アシルとは、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、ピバロイル などの炭素数 2~5 個のアルカノイルまたはベンゾイルなどが挙げられ、ベンゾ イルのフェニル環上にハロゲン、ニトロ、アミノ、水酸基、トリフルオロメチル、 炭素数 1~6 個のアルキル、炭素数 1~6 個のアルコキシから選ばれる 1~3 個の の 置換基を有していてもよい。

アシルオキシとは、アシル部が前記した炭素数2~5個のアルカノイルまたはベンゾイルであって、アセチルオキシ、プロピオニルオキシ、プチリルオキシ、イソブチリルオキシ、ピバロイルオキシ、ベンゾイルオキシなどが挙げられ、ベンゾイルのフェニル環上にハロゲン、ニトロ、アミノ、水酸基、トリフルオロメチル、炭素数1~6個のアルコキシから選ばれる1~3個の置換基を有していてもよい。

炭素数 $2 \sim 6$ 個のアルケニルとは、たとえばビニル、アリル、1 - プロペニル、 1 - プテニル、 <math>2 - プテニル、 1 - ヘキセニル びが挙げられる。

炭素数3~7個のシクロアルキルとは、たとえばシクロプロピル、シクロプチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチルが挙げられ、炭素数1~4個のアルキルにより置換されていてもよい。

前記フェニル、チエニル、フリル、ピリジル、インドリル、ビフェニルにあっては、その環上にハロゲン、ニトロ、アミノ、水酸基、トリフルオロメチル、炭

素数1~6個のアルキル、炭素数1~6個のアルコキシから選ばれる1~3個の 置換基を有していてもよい。

一般式(I)で表される化合物(以下、化合物(I)という)のうち、Aとしては、 $-N(CH_3)$ -または直接結合が好ましい。X, Yはそれぞれ酸素原子または水素 2 原子が好ましい。 R^2 , R^3 は共に水素または共にメチルが好ましい。 R^4 は水素が好ましい。 R^5 , R^6 は共にフェニルが好ましい。ただし、Aが直接結合、かつXおよびYが共に水素 2 原子、かつ R^1 が水素、かつ R^2 , R^3 が共に水素である場合を除く。

本発明化合物は分子内に不斉原子を有しているので、光学異性体、ジアステレ オ異性体またはこれらの混合物のいずれの形態も包含する。また、本発明はシス ・トランス異性体も包含するが、本発明においてはシス異性体が好ましい。

また、本発明化合物は分子内に塩基性基を有することから、通常の有機酸、無機酸と酸付加塩を形成することができる。医薬上許容されうる酸付加塩としては、たとえば酢酸、プロピオン酸、コハク酸、グリコール酸、乳酸、リンゴ酸、酒石酸、クエン酸、アスコルビン酸、マレイン酸、フマル酸、メタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸などの有機酸、塩酸、臭化水素酸、硫酸、燐酸、硝酸などの無機酸との塩である。また、カルボキシル基を有する場合には、金属(ナトリウム、カリウム、カルシウム、アルミニウムなど)、アミノ酸(リジン、オルニチンなど)との塩とすることもできる。

3-シヒドロベンゾフラン-7-イル) メチル) アミノー2-ベンズヒドリルキ ヌクリジン、シスー3ー〔(2,2-ジメチルー5-メチルチオー2,3-ジヒ ドロベンゾフランー7ーイル) メチル] アミノー2ーベンズヒドリルキヌクリジ ン、シスー3ー〔(2,2ージメチルー2,3ージヒドロベンゾフランー7ーイ ル) メチル) アミノー2ーベンズヒドリルキヌクリジン、シスー3ー〔(6-ク ロロー3, 4-ジヒドロー4-メチルー2H-1, 4-ベンズオキサジン-8-イル) メチル) アミノー2ーベンズヒドリルキヌクリジン、シス-N-〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)] -6-クロロ-2, 2-ジメチルー3,4-ジヒドロー4-メチルー2H-1, 4-ベンズオキサジンー8-カルボキサ ミド、シス-N-〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕-5-メチル チオー2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、シス-N-〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-5-ベンジルチオー2,3-ジヒド ロベンゾフランー7-カルボキサミド、シス-N-〔3-〔2-ベンズヒドリル キヌクリジニル)] -5-イソプロピルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、シス-N- (3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)) -2,2-ジメチル-5-メタンスルホニル-2,3-ジヒドロベンゾフランー 7-カルボキサミド、シス-N-〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕 -5-メタンスルホニル-2,3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、 シス-N-[3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-2,2-ジメチル-5-ジメチルアミノ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、 シスー3-[(6-クロロー3,4-ジヒドロー2,2-ジメチルー4ーメチル -2H-1, 4-ベンズオキサジン-8-イル) メチル) アミノ-2-ベンズヒ ドリルキヌクリジン、シスー3ー〔(5-メチルチオー2,3-ジヒドロベンゾ フランー7ーイル) メチル] アミノー2ーベンズヒドリルキヌクリジン、シスー 3- [(5-ベンジルチオー2, 3-ジヒドロベンゾフランー7-イル) メチル] アミノー2-ベンズヒドリルキヌクリジン、シス-3-〔(5-イソプロピルチ オー2, 3ージヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル]アミノー2ーベンズヒ ドリルキヌクリジン、シスー3ー〔(2,2ージメチルー5ーメタンスルホニル

-2, 3-9ヒドロベンゾフラン-7-4ル)メチル〕アミノ-2-4ベンズヒドリルキヌクリジン、シス-3-6(5-4タンスルホニル-2, 3-9ヒドロベンゾフラン-7-4ル)メチル〕アミノ-2-4ベンズヒドリルキヌクリジン、シス-3-6(2, 2-9メチル-5-9メチルアミノ-2, 3-9ヒドロベンゾフラン-10, 11, 12, 13, 13, 14, 13, 14, 15, 15, 15, 15, 15, 15, 17, 18, 19, 1

また、本発明は、前記一般式(I)で表されるキヌクリジン化合物またはその 医薬上許容されうる酸付加塩の治療上有効量と、医薬上許容されうる添加剤から なる医薬組成物を提供する。

さらに、本発明は、前記一般式(I)で表されるキヌクリジン化合物またはその医薬上許容されうる酸付加塩を有効成分として含有することを特徴とする鎮痛抗炎症薬;咳、喀痰を伴う慢性気管支炎、喘息、鼻炎などの呼吸器系疾患の治療薬;不安症、精神病などの中枢神経系疾患の治療薬;高血圧症、心不全などの循環器系疾患の治療薬;および過敏性大腸炎、潰瘍性大腸炎、クローン病などの消化器系疾患の治療薬を提供する。

前記一般式(I)で表されるキヌクリジン化合物としては次の表に示す化合物が含まれる。

$$\begin{array}{c|c}
R^1 & & X \\
R^2 & & R^3
\end{array}$$

$$\begin{array}{c|c}
R^4 & & R^6 \\
R^5 & & & \end{array}$$

						÷		
No.	R ¹	R²	R³	R4	R°	R ⁶	Х	Y
1	5-C1	H	Н	H	CeHs	C ₆ H ₅	H ₂	0
2	5-Br	H	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	H ₂	, 0
3	5-F	H	Н	H	CeHs	C 6 H 5	H ₂	0
4	5-CH ₃	H	Н	H	C ₆ H ₅	СеНь	H_2	0
5	5-C2H5	Н	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	H_2	. 0
6	5-CH2CH2CH3	Н	H	H	CeH5	CeHs	H ₂	0
7	5-CH(CH ₃) ₂	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	0
8	5-CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	0
9	5-0CH ₃	H	H	H	C.H.	CeHs	H ₂	0
10	5-0C ₂ H ₅	H	Н	H	CeH5	C ₆ H ₅	H ₂ .	0
11	5-0CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	0
12	5-0C ₆ H ₅	H	H	H	CeH5	CeHs	H_2	0
13	5-COCH ₃	Н	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	0
14	5-0C0CH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	0
15	5-0H	Н	H	Н	C.H.	C ₆ H ₅	H_2	0
16	5-NH ₂	Н	Н	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	0
17	5-N0 ₂	Н	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	0
18	5-CN	Н	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	0 -
19	5-NHCOCH ₃	H	Н	Н	CeHs	CeHs	H_2	0
20	5-NHCOC & H s	Н	H	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	0

No.	R1	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Х	Y
21	5-SCH ₃	Н	Н	Н	C ₆ H ₅	C 6 H 5	H_2	0
22	5-SC ₂ H ₅	Н	Н	Н	C ₆ H ₅	C 6 H 5	H_2	0
23	5-SCH(CH ₃) ₂	Н	Н	H	C ₆ H ₅	C 6 H 5	H_2	0
24	5-S0 ₂ CH ₃	H	H	H	C _e H ₅	C ₆ H ₅	H_2	0
25	5-S0 ₂ C ₂ H ₅	H	H	Н	CeHs	CeHs	H ₂	0
26	5-SO ₂ CH(CH ₃) ₂	Н	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	H ₂	0
27	5-SC ₆ H ₅	H	H	Н	CeHs	CeHs	H ₂	0
28	5-SCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	Н	C & H 5	C ₆ H ₅	H ₂	0
29	5-NHSO2CH3	Н	Н	H	CoHs	СвНь	H ₂	0
30	5-NHS0 ₂ C ₂ H ₅	H	Ħ	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	0
31	5-NHS0 ₂ C ₈ H ₅	H	H	H	C & H 5	CeHs	H ₂	0
32	5-C00H	H	H	H	СвНъ	C ₆ H ₅	H_2	0
33	5-C00CH ₃	H	H	н .	CeHs	C & H 5	H2	. 0
34	5-C00C ₂ H ₅	Н	H	H	CeHs	CeHs	H_2	0
35	5-C00CH ₂ C ₆ H ₅	H	Н	H	C ₈ H ₅	CeHs	H_2	0
36	5-N(CH ₃) ₂	H	H	H	C 6 H 5	C 6 H 5	H2	0
37	5-NHCH3	H	H	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	H ₂	0
38	5-NH(C ₂ H ₅) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	0
39	5-CONH ₂	H	H	H	CeHs	CeHs	H2	0
40	5-CONHCH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	H ₂	0
41	5-CON(CH ₈) ₂	H	H	H	C 6 H 5	C 6 H 5	H ₂	0
42	5-OCONHCH ₃	H	H	H	C_6H_5	CeHs	H_2	0
43	5-0CON(CH ₃) ₂	H	Н	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	0
44	5-OCONHCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	Н	CaHs	C ₆ H ₅	H_2	0
45	5-OCSNHCH ₃	H	H	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	0
46	5-0CSN(CH ₃) ₂	H	Н	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	0

No.	R1	R²	R³	R ⁴	R⁵	R ⁶	X	Y
47	5-OCSNHCH2C6H5	Н	H	H	CeHs	CeH5	H ₂	0
48	5-S02NHCH3	H	H	H	CaHs	C ₈ H ₅	H_2	0
49	5-S0 ₂ N(CH ₃) ₂	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	0
50	5-S02NHC2H5	H	H	H	CsHs	C ₆ H ₅	H ₂	0
51	5-S0 ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	0
52	5-S02NHC6H5	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	H_2	0
53	5-CF ₃	H	H	Н	CeH5	CeHs	H ₂	0
54	4-CI	H	Н	Н	C s H s	C ₆ H ₅	H ₂	. 0
5 5	4-Br	Н	H.	H	CeHs	C ₆ H ₅	H ₂	0
56	4-F	H	Н	Н	CeH5	C ₆ H ₅	H ₂	0
57	4-CH ₃	H	H	Н	CeHs	C ₆ H ₅	H ₂	0
58	4-C ₂ H ₅	H	Н	Н	CeHs	C _e H ₅	H ₂	0
59	4-CH(CH ₃) ₂	H	Н	H	CeHs	CeH5	H_2	0
60	4-CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	H ₂	0
61	4-0CH ₃	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	0
62	4-0C ₂ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	0
63	4-0CH ₂ C ₆ H ₅	H	Н	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	0
64	4-0C ₆ H ₅	H	H	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	H_2	0
65	4-COCH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	H_2	0
66	4-0COCH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	H2	0
67	4-0H	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	0
68	4-NH ₂	H	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	H_2	0
69	4-N0 ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	0
70	4-CN	Н	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	H ₂	0
71	4-NHCOCH ₃	H	H	<u> </u>	CeH5	CeH5	H ₂	0

No.	R¹	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R ^e	Х	Y
72	4-NHCOC 6H5	Н	Н	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	0
73	4-SCH ₃	Н	Н	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	0
74	4-SC ₂ H ₅	Н	Н	Н	СеНь	C ₆ H ₅	H ₂	0
7 5	4-CH2CH2CH3	Н	H	Н	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	0
76	4-SCH(CH ₃) ₂	Н	H	Н	C ₆ H ₅	СеНь	H ₂	0
77	4-S0 ₂ CH ₃	Н	H	Н	CsHs	C 6 H 5	H ₂	0
78	4-S0 ₂ C ₂ H ₅	H	H	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	0
79	4-S0 ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	Н	C ₆ H ₅	CeHs	H ₂	. 0
80	4-SC ₆ H ₅	H	H	н .	C 6 H 5	C ₆ H ₅	H ₂	0
81	4-SCH ₂ C ₆ H ₅	H	Ħ	H	C 8 H 5	C 6 H 5	H ₂	0
82	4-NHSO ₂ CH ₃	H	H	Н .	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	0
83	4-NHSO ₂ C ₂ H ₅	H	Н	Н	CeHs	C & H 5	H_2	0
84	4-NHSO ₂ C ₆ H ₅	H	Н	H	C ₆ H ₅	C & H 5	H_2	0
85	4-C00H	H	H	H	C 6 H 5	C 6 H 5	H_2	0
86	4-C00CH ₃	Н.	H	H	C ₈ H ₅	CeHs	H_2	0
87	4-C00C ₂ H ₅	H	H	H	C 6 H 5	C 6 H 5	H_2	0
88	4-C00CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	H_2	0
89	4-N(CH ₃) ₂	H	H	H	CeHs	CeH5	H_2	0
90	4-NHCH ₃	H	H	H	CeHs	C 6 H 5	H_2	0
91	4-NH(C ₂ H ₅) ₂	H	H	H	CeHs	CeHs	H_2	0
92	4-CONH ₂	H	Н	Н	CeHs	CeH5	H ₂	0
93	4-CONHCH ₈	H	Н	Н	C & H &	CeH5	H_2	0
94	4-CON(CH ₃) ₂	H	Н	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	0
95	4-OCONHCH ₃	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	0
96	4-0CON(CH ₃) ₂	H	H	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	0
97	4-OCONHCH ₂ C ₆ H ₅	Н	H	Н	CeHs	C ₆ H ₅	H2	0

No.	R¹	R ²	R³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	X	Y
98	4-OCSNHCH₃	H	Н	Н	CeH5	C ₆ H ₅	H_2	0
99	4-0CSN(CH ₃) ₂	H	Н	H	CeHs	CeHs	H_2	0
100	4-OCSNHCH ₂ C ₆ H ₅	Ĥ	Н	H	CeH5	C ₆ H ₅	H ₂	0
101	4-SO2NHCH3	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	H_2	0
102	4-S0 ₂ N(CH ₃) ₂	H	Н	Н	СвНь	CeHs	H_2	0
103	4-S02NHC2H5	H	Н	H	CeH5	C ₈ H ₅	H_2	0
104	4-S0 ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	H	Н	Н	C ₈ H ₅	CeHs	H_2	0
105	4-S02NHC6H5	H	Н	H	CeHs	CeHs	H_2	0
106	4-CF ₃	H	Н	H	CeHs	CeHs	H_2	0
•			•					
107	6-CI	Н	H	Н	CeHs	CeHs	H_2	0
108	6-Br	H	Н	H	CeH5	CeHs	H_2	0
109	6-F	H	Н	Н	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	0
110	6-CH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	0
111	6-C ₂ H ₅	H	Н	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	0
	5-S0 ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	Н	СеНь	CeH5	H_2	0
113	6-CH(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	0
114	6-CH ₂ C ₆ H ₅	H	Н	H	CeHs	CeH5	H_2	0
115	6-0CH ₃	H	Н	H	CeHs	CeHs	H_2	0
116	6-0C ₂ H ₅	H	Н	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	0
117	6-OCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	CeHs	CeHs	H_2	0
118	6-0C ₆ H ₅	H	H	Н	CeH5	C ₆ H ₅	H ₂	0
119	6-COCH ₃	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	0
120	6-0COCH ₃	H	H	Н	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	0
121	6-0H	H	H	H	СвНБ	C ₆ H ₅	H ₂	0
122	6-NH ₂	Н	Н	Н	CeH5	CeH5	H 2	0

No.	R¹	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	X	Y
123	6-N0 ₂	Н	Н	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	0
124	6-CN	Н	Н	H	СеНь	CaHs	H_2	0
125	6-NHCOCH₃	Н	Н	Н	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	0
126	6-NHCOC ₆ H ₅	H	H	Н	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	0
127	6-SCH ₃	Н	Н	Н	C _e H ₅	CeHs	H ₂	0
128	6-SC ₂ H ₅	Н	Н	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	0
129	6-SCH(CH ₃) ₂	H	Н	H	CeHs	CeHs	H ₂	0
130	6-SO ₂ CH ₃	Н	Н	Н	C ₆ H ₅	CeHs	H ₂	0
131	6-S0 ₂ C ₂ H ₅	H	Н	H	CeHs	CeHs	H ₂	0
132	6-SO ₂ CH(CH ₃) ₂	Н	·H	Н	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	0
133	6-SC ₆ H ₅	н .	H	Н	CeHs	CeHs	H_2	0
134	6-SCH ₂ C ₆ H ₅	Н	H	Н	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	0
135	6-NHSO ₂ CH ₃	Н	H	Н	CeHs	CeH5	H_2	0
136	6-NHSO ₂ C ₂ H ₅	Н	H	H	C 8 H 5	CeHs	H_2	0
137	6-NHSO ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C 6 H 5	C & H 5	H ₂	0
138	6-COOH	H	H	H	C_6H_5	CeHs	H_2	0
139	6-C00CH ₃	H	H	H	CeHs	C 6 H 5	H_2	0
140	6-C00C ₂ H ₅	Н	H	H	C 6 H 5	C 6 H 5	H_2	0
141	6-C00CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C 6 H 5	C 6 H 5	H_2	0
142	6-N(CH ₃) ₂	Н	H	H	CeHs	C 6 H 5	H_2	0
143	6-NHCH ₃	Н	H	H	CoHo	C 6 H 5	H_2	0
144	6-NH(C ₂ H ₅) ₂	H	H	H	C 6 H 5	C 6 H 5	H_2	0
145	6-CONH ₂	H	H	H	C & H 5	C 6 H 5	H_2	0
146	6-CONHCH ₃	Н	H	Н	C ₈ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	0
147	6-CON(CH ₃) ₂	H	H	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	0
148	6-OCONHCH₃	Н	H	H	C & H &	C 6 H 5	H ₂	0

No.	R1	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Х	Y
149	6-0CON(CH ₃) ₂	Н	Н	Н	CeH5	CeH5	H ₂	0
150	6-OCONHCH2CeHs	Н	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	H ₂	0
151	6-OCSNHCH3	H	H	Н	CeH5	CeHs	H_2	0
152	6-0CSN(CH ₈) ₂	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	H ₂	0
153	6-OCSNHCH2C6H5	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	H ₂	0
154	6-SO2NHCH3	H	Н	H	CeHs	CeHs	H ₂	0
155	6-S0 ₂ N(CH ₃) ₂	Н	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	H ₂	0
156	6-SO2NHC2H5	Н	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	0
157	6-S0 ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	Ĥ	Н	Н	CeH5	CeHs	H ₂	0
158	6-SO2NHC6H5	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	0
159	6-CF ₃	H	H	H	CeHs	CeHs	H ₂	0
							•	
160	H	CH ₃	CH3	H	CeH5	C ₆ H ₅	H_2	0
161	5-CI	CH ₃	CH ₃	H	CeH5	CeHs	H_2	0
162	5-Br	CH ₃	CH3	H	CeHs	CeHs	H_2	0
163	5-F	CH ₃	CH ₃	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	0
164	5-CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	CeH5	CeHs	H_2	0
165	5-C ₂ H ₅	CH3	CH ₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	0
166	5-CH2CH2CH3	CH3	CH ₃	H	CeHs	CeHs	H_2	0
167	5-CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	0
168	5-CH2CeH5	СН₃	CH₃	H	CeHs	CeHs	H ₂	0
169	5-0CH ₃	CH3	CH ₃	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	0
170	5-0C ₂ H ₅	CH ₃	CH3	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	0
171	5-0CH ₂ C ₆ H ₅	CH3	CH3	H	CeH5	C ₆ H ₅	H_2	0
172	5-0C ₆ H ₅	CH ₃	СНз	Н	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	0
173	5-COCH ₃	CH3	CH3	Н	C ₆ H ₅	CeH5	H ₂	0_

No.	R¹	R²	R³	R⁴	R 5	R ^e	X	Y
174	5-0COCH ₃	CH3	СН₃	Н	C ₆ H ₅	C _e H ₅	H ₂	0
175	5-0H	CH ₃	CH₃	Н	C ₆ H ₅	C 6 H 5	H_2	0
176	5-NH ₂	CH ₃	CH₃	Н	CeH5	CeHs	H_2	0
177	5-NO ₂	CH3	CH₃	Н	C ₆ H ₅	CeHs	H ₂	0
178	5-CN	CH₃	CH3	Н	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	0
179	5-NHCOCH₃	CH₃	CH₃	Н	CeHs	CeHs	H ₂	0
180	5-NHCOC ₆ H ₅	CH3	CH3	Н	CeHs	C ₆ H ₅	H ₂	0
181	5-SCH ₃	CH₃	CH3	H	CeHs	CeHs	H ₂	0
182	5-SC ₂ H ₅	CH₃	CH3	H	CeHs	CeHs	H ₂	0
183	5-SCH(CH ₃) ₂	CH3	CH ₃	H	C ₆ H ₅	CeHs	H ₂	0
184	5-S0 ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	Н	CaHs	CeHs	H ₂ .	0
185	5-S0 ₂ C ₂ H ₅	CH3	CH ₃	Н	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	0
186	5-S0 ₂ CH(CH ₃) ₂	CH3	CH ₃	Н	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	0
187	5-SC ₆ H ₅	CH3	CH ₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	0
188	5-SCH ₂ C ₆ H ₅	CH3	CH3	H	C 6 H 5	CeHs	H_2	0
189	5-NHSO ₂ CH ₃	CH3	CH3	H	C 8 H 5	CeHs	H_2	0
190	5-NHSO ₂ C ₂ H ₅	CH3	CH₃	H	CeHs	C 6 H 5	H_2	0
191	5-NHSO ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	CH₃	H	CeHs	CeHs	H_2	0
192	5-COOH	CH3	CH₃	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	0
193	5-C00CH ₃	CH3	CH₃	H	СвНь	CeHs	H_2	0
194	5-C00C ₂ H ₅	CH3	CH₃	H	C & H &	CeHs	H ₂	0
95	5-COOCH ₂ C ₆ H ₅	CH3	CH₃	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	H_2	0
96	5-N(CH ₃) ₂	CH3	CH3	H	CeHs	CeHs	H2	0
97	5-NHCH ₃	CH₃	CH3	Н	C 6 H 5	C 6 H 5	H_2	0
98	5-NH(C ₂ H ₅) ₂	CH3	CH3	Н	CeHs	C ₆ H ₅	H ₂	0
99	5-CONH ₂	CH3	CH₃	Н	CeHs	CeH5	H_2	0

No.	R ¹	R²	R³	R ⁴	R ^s	R ^e	Х	Y
200	5-CONHCH3	CH3	СН₃	Н	CeHs	C ₆ H ₅	H ₂	0
201	5-CON(CH ₃) ₂	CH3	CH ₃	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	0
202	5-OCONHCH3	CH ₃	CH₃	H	CeH5	C ₆ H ₅	H_2	0
203	5-0CON(CH ₃) ₂	CH ₃	CH₃	H	CeHs	CeHs	H_2	0
204	5-0CONHCH2C6H5	CH3	CH₃	H	CeHs	CeHs	H_2	0
205	5-OCSNHCH ₃	CH ₃	CH₃	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	0
206	5-0CSN(CH ₈) ₂	CH ₃	CH3	H	CeHe	CeH5	H ₂	0
207	5-OCSNHCH2C6H5	CH ₃	CH₃	H	CeH5	C ₆ H ₅	H ₂	0
208	5-SO ₂ NHCH ₃	СНз	CH₃	H	C ₆ H ₅	CeH5	H_2	0
209	5-S02N(CH3)2	CH ₃	CH ₃	H	CeHs	CeH5	H ₂	0
210	5-SO2NHC2H5	CH ₃	CH ₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	0
211	5-S0 ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	CH ₃	CH₃	H	CeHs	CeH5	H_2	0
212	5-SO2NHC6H5	CH3	CH ₃	H	CeHs	CeH5	H_2	0
213	5-CF ₃	CH3	CH ₃	H	CeHs	CeH5	H ₂	0
214	4-C1	CH₃	СН₃	Н	C ₆ H ₅	C _e H ₅	H ₂	0
215	4-Br	CH3	CH₃	H	CeH5	CeHs	H_2	0
216	4-F	CH3	CH₃	H	CeH5	CeHs	H_2	0
217	4-CH ₃	CH ₃	CH₃	H	C ₆ H ₅	CeH5	H_2	0
218	4-C ₂ H ₅	CH ₃	СН₃	H	CeHs	CeH5	H_2	0
219	4-CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH₃	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	0
220	4-CH ₂ C ₆ H ₅	CH3	CH₃	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	0
221	4-0CH ₃	CH3	CH₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	0
222	4-0C ₂ H ₅	CH ₃	СН₃	H	C ₆ H ₅	CeH5	H_2	0
223	4-0CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	СН₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	0
224	4-0C ₆ H ₅	CH ₃	CH3	Н	C ₆ H ₅	CeHs	H ₂	0

æ

No.	R¹	R²	R³	R⁴	R ⁵	R ⁶	Х	Y
225	4-COCH ₃	СН₃	CH3	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	0
226	4-0COCH ₃	CH ₃	CH₃	Н	CeHs	CeHs	H ₂	0
227	4-0H	CH ₃	CH ₃	Н	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	0
228	4-NH ₂	CH₃	CH ₃	H	C 8 H 5	C ₆ H ₅	H_2	0
229	4-N0 ₂	CH3	CH₃	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	0
230	4-CN	CH₃	CH3	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	0
231	4-NHCOCH ₃	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	0
232	4-NHCOC 6H 5	CH₃	CH₃	Н	СеНь	СвНъ	H ₂	. 0
233	4-SCH ₃	CH3	ĊH₃	Н	C ₆ H ₅	C 6 H 5	H ₂	0
234	4-SC ₂ H ₅	CH ₃	CH3	Н	C ₈ H ₅	C 6 H 5	H ₂	0
235	4-CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH₃	CH ₃	Н	CeHs	CeHs	H ₂	0
236	4-SCH(CH ₃) ₂	CH₃	CH3	H	C ₆ H ₅	C 6 H 5	H_2	0
237	4-S0 ₂ CH ₃	CH3	CH3	H	C & H 5	CeHs	H_2	0
238	4-S0 ₂ C ₂ H ₅	CH₃	CH3	H	CeHs	CeHs	H_2	0
239	4-S0 ₂ CH(CH ₃) ₂	CH3	CH₃	H	C & H 5	C ₆ H ₅ .	H_2	0
240	4-SC ₆ H ₅	CH₃	CH₃	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	H2	0
241	4-SCH ₂ C ₆ H ₅	CH3	CH3	Н	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	0
242	4-NHSO ₂ CH ₃	CH3	CH3	H	CeHs	C 6 H 5	H ₂	0
243	4-NHS0 ₂ C ₂ H ₅	CH3	CH3	H	C ₈ H ₅	C ₆ H ₅	H2	0
244	4-NHSO ₂ C ₆ H ₅	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	0
245	4-C00H	CH ₃	CH₃	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	H_2	0
246	4-C00CH ₃	CH₃	CH ₃	Н	CeHs	CeHs	H_2	0
247	4-C00C ₂ H ₅	CH₃	CH ₃	Н	CeHs	C 6 H 5	H_2	0
248	4-C00CH ₂ C ₆ H ₅	CH₃	CH ₃	Н	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	0
249	4-N(CH ₃) ₂	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	0
250	4-NHCH₃	CH3	CH₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	0

No.	R ¹	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Х	Y
251	4-NH(C ₂ H ₅) ₂	CH ₈	СНз	H	CeHs	C ₈ H ₅	H_2	0
252	4-CONH ₂	CH ₃	CH₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	0
253	4-CONHCH₃	CH3	CH3	H	CeHs	CeH5	H ₂	0
254	4-CON(CH ₃) ₂	CH3	CH ₃	H	C ₆ H ₅	CeHs	H ₂	0
255	4-OCONHCH3	CH3	CH3	H	CeHs	CeHs	H_2	0
256	4-0CON(CH ₃) ₂	CH3	CH ₃	H	CeHs	C ₆ H ₅	H ₂	0
257	4-OCONHCH2C6H5	CH ₃	СН₃	H	CeH5	CeHs	H ₂	0
258	4-OCSNHCH ₃	CH3	CH₃	H	CeH5	CeHs	H ₂	0
259	4-0CSN(CH ₃) ₂	CH3	CH3	H	CeHs	C ₆ H ₅	H ₂	0
260	4-OCSNHCH ₂ C ₆ H ₅	CH3	CH3	H	CeH5	CeHs	H_2	0
261	4-SO2NHCH3	CH3	CH3	H	CeH5	CeHs	H_2	0
262	4-S0 ₂ N(CH ₃) ₂	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	CeH5	H_2	0
263	4-S02NHC2H5	CH ₃	CH3	H	CeH5	CeHs	H_2	0
264	4-S0 ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	CH3	CH3	H	CeH5	CeHs	H_2	0
265	4-SO2NHC6H5	CH3	CH3	H	CeHs	CeHs	H_2	0
266	4-CF ₃	CH3	CH₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	0
267	6-C1	CH₃	CH₃	H	CeH5	C ₆ H ₅	H_2	0
268	6-Br	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	0
269	6-F	CH3	CH₃	H	CeHs	CeHs	H_2	0
270	6-CH ₃	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	0
271	6-C ₂ H ₅	CH ₃	CH3	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	0
272	6-S0 ₂ CH(CH ₃) ₂	CH3	CH3	H	CeHs	CeHs	H_2	0
273	6-CH(CH ₃) ₂	CH₃	CH3	H	CeHs	CeH5	H_2	0
274	6-CH ₂ C ₆ H ₅	CH3	СН₃	H	CeHs	CeH5	H_2	0
275	6-0CH ₃	CH ₃ _	CH3_	H	CeH5	CeH5	H ₂	0

No.	R ¹	R²	R³	R ⁴	R⁵	R ⁶	Х	Y	_
276	6-0C ₂ H ₅	CH₃	СН₃	Н	C 6 H 5	C ₆ H ₅	H_2	0	
277	6-0CH ₂ C ₆ H ₅	СНз	CH₃	Н	CaHs	CeH5	H ₂	0	
278	6-0C ₆ H ₅	CH ₃	CH3	H	CeHs	C ₆ H ₅	H ₂	0	
279	6-COCH₃	СНз	CH3	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	0	
280	6-0C0CH ₃	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	0	
281	6-0H	CH3	CH₃	H	CeH5	CeH5	H ₂	0	
282	6-NH ₂	CH ₃	CH₃	Н	CeH5	C ₆ H ₅	H_2	0	
283	6-NO ₂	CH3	CH ₃	Н	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	0	
284	6-CN	CH₃	CH ₃	Н	CeHs	CeH5	H ₂	0	
285	6-NHCOCH₃	CH₃	CH ₃	Н	C 8 H 5	CeHs	H_2	0	
286	6-NHCOC 6 H 5	CH₃	CH3	H	CeHs	CeHs	H_2	0	
287	6-SCH₃	CH3	CH ₃	H	C_6H_5	C ₆ H ₅	H_2	0	
288	6-SC ₂ H ₅	CH3	CH ₃	н .	C 6 H 5	C. 8 H 5	H_2	0	
289	6-SCH(CH ₃) ₂	CH3	CH3	H	C 6 H 5	CeHs	H ₂	0	
290	6-S0 ₂ CH ₃	CH₃	CH ₃	H	C 6 H 5	CeHs	H ₂	0	
291	6-S0 ₂ C ₂ H ₅	CH3	CH ₃	Н	C 8 H 5	C 6 H 5	H_2	0	
292	6-S0 ₂ CH(CH ₃) ₂	CH3	CH ₃	H	CeHs	C 6 H 5	H_2	0	
293	6-SC ₆ H ₅	CH3	CH₃	H	C_6H_5	C ₆ H ₅	H_2	0	
294	6-SCH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	CH3	H	CeH5	CeHs	H ₂	0	
295	6-NHSO ₂ CH ₃	CH3	CH3	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	H ₂	0	
296	6-NHSO ₂ C ₂ H ₅	CH3	CH₃	H	CeHs	C 6 H 5	H_2	0	
297	6-NHSO ₂ C ₆ H ₅	CH3	CH3	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	H_2	0	
298	6-COOH	CH₃	CH3	H	CeH5	CeHs	H2	0	
299	6-C00CH ₃	CH3	CH₃	H	C _e H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	0	
300	6-C00C ₂ H ₅	CH3	CH3	Н	C e H 5	CeH5	H2	0	
301	6-COOCH ₂ C ₆ H ₅	CH3	CH3	H	CeHs	C 6 H 5	H ₂	0	

No.	R¹	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	X	Y
302	6-N(CH ₃) ₂	CH3	CH ₃	H	C ₆ H ₅	CeHs	H ₂	0
303	6-NHCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	0
304	6-NH(C ₂ H ₅) ₂	CH3	СНз	H	C.H.	CeHs	H ₂	0
305	6-CONH ₂	CH3	CH ₃	H	CeHs	CeHs	H_2	0
306	6-CONHCH3	CH ₃	CH₃	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	0
307	6-CON(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	H	CeH5	CeHs	H_2	0
308	6-OCONHCH3	CH ₃	CH₃	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	0
309	6-0CON(CH ₃) ₂	CH3	CH ₃	H	CeH5	CeHs	H_2	0
310	6-OCONHCH2C6H5	CH ₃	CH ₃	H	CeHs	CeHs	H_2	0
311	6-OCSNHCH₃	CH3	CH₃	H	CeHs	CeHs	H_2	0
312	6-0CSN(CH ₃) ₂	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	0
313	6-OCSNHCH2C6H5	CH ₃	CH₃	H	CeHs	CeHs	H_2	0
314	6-SO2NHCH3	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	0
315	6-SO ₂ N(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	H	CeH5	CeHs	H_2	0
316	6-SO2NHC2H5	CH3	CH3	H	CeHs	CeHs	H_2	0
317	6-SO ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	CH3	CH₃	H	CeH5	CeH5	H_2	0
318	6-SO2NHC6H5	CH3	CH ₃	H	CeHs	CeHs	H_2	0
319	6-CF ₃	CH3	CH3	H	CeH5	C ₆ H ₅	H ₂	0
320	5-SCH₃	СНз	Н	Н	CeH5	C ₆ H ₅	H_2	0
321	5-SC ₂ H ₅	CH3	H	H	C 6 H 5	CeHs	H_2	0
322	5-SCH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	H ₂	0
323	5-S0 ₂ CH ₃	CH ₃	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	0
324	5-S0 ₂ C ₂ H ₅	CH3	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	0
325	5-S0 ₂ CH(CH ₃) ₂	CH3	Н	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	0
326	5-SC _e H _s	CH ₃	Н	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	0_

WO 93/09116 PCT/JP92/01426

No.	R¹	R²	R³	R ⁴	R 5	R ⁶	X	Y
327	5-CF ₃	CH₃	H	Н	C ₆ H ₅	CeHs	H ₂	0
328	5-01	Н	Н	Н .	C 6 H 5	C ₆ H ₅	H ₂	H ₂
329	5-Br	H	H	H	CeHs	C 6 H 5	H ₂	H_2
330	5-F	H	H	H	C ₆ H ₅	C 6 H 5	H_2	H_2
331	5-CH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	H_2	H_2
332	5-C ₂ H ₅	H	H	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	H_2
333	5-CH ₂ CH ₂ CH ₃	Н	Н	. Н	C 6 H 5	C 6 H 5	H_2	H_2
334	5-CH(CH ₃) ₂	H	H	Н	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	Н ₂
335	5-CH ₂ C ₆ H ₅	H	Ħ	Н	C & H 5	C & H 5	H_2	H2
336	5-0CH ₃	H	H	Н	C 8 H 5	CeHs	H_2	H ₂
337	5-0C ₂ H ₅	H	H	H	CeHs	C ₈ H ₅	H_2	H ₂
338	5-0CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	H ₂	H ₂
339	5-0C ₆ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C 6 H 5	H_2	H ₂
340	5-COCH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	C 6 H 5	H_2	H ₂
341	5-0C0CH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	H ₂
342	5-0H	H	H	H	C 6 H 5	CeHs	H_2	H_2
343	5-NH ₂	H	H	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	H_2	H ₂
344	5-N0 ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	H ₂
345	5-CN	Н	H	Н	CeH5	CeHs	H_2	H_2
346	5-NHCOCH ₃	H	Н	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	H ₂
347	5-NHCOC 6H5	Н	Н	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	H ₂
348	5-SCH₃	H	H	H	C & H &	CeHs	H_2	H ₂
349	5-SC ₂ H ₅	Н	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	H_2
350	5-SCH(CH ₃) ₂	Н	Н	H	C & H &	C ₆ H ₅	H_2	H_2
351	5-SO ₂ CH ₃	Н	Н	Н	C e H 5	C e H 5	H ₂	H2

NO.	R¹	R²	R³	R ⁴	R ^s	R ⁶	Х	Y
352	5-S0 ₂ C ₂ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	H ₂
353	5-S0 ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	H_2
354	5-SC _e H ₅	H	H	H	CeH5	CeHs	H ₂	H ₂
355	5-SCH2C6H5	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	H ₂	H ₂
356	5-NHSO2CH3	H	H	H	CeHs	CeHs	H_2	H ₂
357	5-NHSO ₂ C ₂ H ₅	Н	H	H	CeH5	CeHs	H_2	H ₂
358	5-NHSO ₂ C ₆ H ₅	H	Н	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	H_2
359	5-C00H	H	Н	H	CeHs	CsHs	H_2	H ₂
360	5-C00CH ₃	Н	H ·	H	CeHs	CeHs	H_2	H ₂
361	5-C00C ₂ H ₅	H	H.	H	CeHs	CeHs	H_2	H_2
362	5-C00CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	CeH5	CaHs	H_2	H ₂
363	5-N(CH ₃) ₂	Н -	H	H	C ₈ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	H_2
364	5-NHCH3	H	H	н .	C ₆ H ₅	CeH5	H_2	H ₂
365	5-NH(C ₂ H ₅) ₂	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	H ₂
366	5-CONH2	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	H ₂	H ₂
367	5-CONHCH3	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	H ₂	H_2
368	5-CON(CH ₃) ₂	H	H	H	CeHs	CeH5	H_2	H_2
369	5-0CONHCH3	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	H ₂	H ₂
370	5-0CON(CH ₃) ₂	H	H	H	CeHs	CeHs	H_2	H ₂
371	5-0CONHCH2C6H5	H	H	H.	CeHs	CeH5	H_2	H_2
372	5-OCSNHCH3	H	H	H	CeHs	C_6H_5	H_2	H_2
373	5-0CSN(CH ₃) ₂	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	H ₂
374	5-OCSNHCH2C6H5	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	H_2
375	5-SO2NHCH3	H	H	H	C _e H ₅	CeH5	H_2	H_2
376	5-S0 ₂ N(CH ₃) ₂	H	H	H	CeHs	CeH5	H_2	H ₂
377	5-SO2NHC2H5	Н	H	Н	CeH5	C ₆ H ₅	H ₂	H ₂

No.	R ¹	R²	R³	R⁴	R ⁵	R ⁶	X	Y
378	5-SO ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	Н	Н	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	H ₂
379	5-SO2NHC6H5	Н	Н	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	H_2	H ₂
380	5-CF ₃	H	H	Н	C ₈ H ₅	C ₆ H ₅	Н₂	H ₂
381	4-C1	Н	Н	Н	C ₆ H ₅	СеНъ	H ₂	H_2
382	4-Br	H	Н	H	CeHs	C 6 H 5	H_2	H ₂
383	4-F	H	H	H	СеНь	C 8 H 5	H_2	H ₂
384	4-CH ₃	Н	H	H	CeH5	CeHs	H ₂	H ₂
385	4-C ₂ H ₅	Н	Н	H	CeHs	C 6 H 5	H_2	H ₂
386	4-CH(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C6H5	H ₂	H ₂
387	4-CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	CeHs	CeHs	H_2	H ₂
388	4-0CH ₃	Н	H	Н	C 6 H 5	CeH5	H ₂	H ₂
389	4-0C ₂ H ₅	H	H	H	C 6 H 5	CeHs	H_2	H_2
390 ·	4-0CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	Н	CeHs	C & H 5	H ₂	H ₂
391	4-0C 6H 5	H	H	H	CeH5	CeH5	H ₂	H_2
392	4-COCH ₃	H	H	Н	C & H &	C 8 H 5	Н₂	H_2
393	4-OCOCH ₃	H	H	H	C & H 5	C 8 H 5	H ₂	H_2
394	4-0H	H	H	H	CeHs	C 6 H 5	H_2	H_2
395	4-NH 2	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	H ₂
396	4-N0 ₂	H	H	H	CeHs	C 6 H 5	H_2	H ₂
397	4-CN	H	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	H_2	H_2
398 4	4-NHCOCH₃	H	H	Н	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	H_2
399 4	4-NHCOC 6 H 5	Н	H	Н	C 6 H 5	CeHs	H ₂	H2
100 4	4-SCH₃	H	H	H	CeHs	C 6 H 5	H_2	H_2
101 4	4-SC2H5	H	H	H	CeHs	C 6 H 5	H_2	H_2
102 4	1-CH2CH2CH3	Н	н	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	H ₂

	R ¹	R ²	R³	R4	R ⁵	R ⁶	X	Y
403	4-SCH(CH ₃) ₂	Н	Н	Н	C ₈ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	H ₂
404	4-S0 ₂ CH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	H_2
405	4-S02C2H5	H	Н	H	СвНъ	CeH5	H2	H ₂
406	4-S02CH(CH3)2	Н	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	H_2
407	4-SC ₆ H ₅	H	Н	Н	CeHs	CeHs	H_2	H ₂
408	4-SCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	Н	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	H_2
409	4-NHSO ₂ CH ₃	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	H_2
410	4-NHSO ₂ C ₂ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	H_2	H_2
411	4-NHS0 ₂ C ₆ H ₅	Н	Н	H	C ₆ H ₅	CeHs	H ₂	H ₂
412	4-C00H	H	·H	H	CeH5	CeHs	H_2	H ₂
413	4-C00CH ₃	H	H	H	СвНб	CeHs	H_2	H ₂
414	4-C00C ₂ H ₅	H	H	H	CeHs	CeH5	H_2	H ₂
415	4-C00CH ₂ C ₆ H ₅	H	Н	H	СеНь	CeHs	H_2	H ₂
416	4-N(CH ₃) ₂	H	Н	H	CeHs	CeHs	H_2	H_2
417	4-NHCH₃	H	H	Н	СеНъ	CeHs	H_2	H ₂
418	4-NH(C ₂ H ₅) ₂	Н .	H'	Н	СвНъ	CeHs	H ₂	H ₂
419	4-CONH ₂	H	Н	H	CeHs	CeHs	H_2	H_2
420	4-CONHCH3	H	Н	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	H_2
421	4-CON(CH ₃) ₂	H	Н	H	CaHs	C ₆ H ₅	H ₂	H ₂
422	4-OCONHCH ₃	H	H	H	C _e H ₅	CeHs	H_2	H ₂
423	4-0CON(CH ₃) ₂	H	Н	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	H ₂
424	4-OCONHCH ₂ C ₆ H ₅	H	Н	Н	CeH5	C ₆ H ₅	H_2	H ₂
425	4-OCSNHCH₃	Н	Н	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	H_2
426	4-0CSN(CH ₃) ₂	 H	Н	H	CeHs	C ₆ H ₅	H ₂	H ₂
427	4-OCSNHCH ₂ C ₆ H ₅	H	Н	H	CeHs.	C ₆ H ₅	H_2	H ₂
428	4-SO ₂ NHCH ₃	H	H	Н	CeHs	C ₆ H ₅	H ₂	H ₂ _

	R ¹	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	X	Y
429	4-S0 ₂ N(CH ₃) ₂	Н	Н	Н	C ₆ H ₅	C 6 H 5	H ₂	H ₂
430	4-S02NHC2H5	H	H	H	СеНь	C 6 H 5	H_2	H_2
431	4-S0 ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	H	Н	Н	C ₆ H ₅	C 6 H 5	H_2	H_2
432	4-S02NHC6H5	H	Н	H	CeHs	C6H5	H_2	H_2
433	4-CF ₃	Н	Н	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	H ₂
434	6-C1	Н	Н	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	H ₂
435	6-Br	H	H	H	CeHs	CeHs	H_2	H2
436	6-F	H	H	H	CeHs	CeHs	H ₂	H ₂
437	6-CH ₃	H	Ħ	H	CeH5	CaHs	H_2	H_2
438	6-C ₂ H ₅	H	H	H	СвНь	CeH5	H_2	H_2
439	5-S0 ₂ CH(CH ₃) ₂	Н	Н	Н	CeHs	CeHs	H_2	H2
440	6-CH(CH ₃) ₂	Н	H	H	CeH5	CeHs	H_2	H ₂
441	6-CH ₂ C ₆ H ₅	H	Н	Н	CeHs	CeH5	H ₂	H_2
442	6-0CH ₃	Н	H	Н	CeHs	CeH5	H_2	H_2
443	6-0C ₂ H ₅	H	H	H	CeH5	CeH5	H_2	H_2
444	6-0CH ₂ C ₆ H ₅	Н	H	Н	CeHs	CeHs	H_2	H ₂
445	6-0C 6 H 5	Н	H	H	CeHs	CeHs	H_2	H2
446	6-COCH ₃	Н	Н	H	C 6 H 5	CeHs	H_2	H2
447	6-0C0CH3	H	H	H	CeHs	CeH5	H_2	H ₂
448	6-0H	Н	H	H	C 8 H 5	C & H 5	H_2	H_2
449	6-NH ₂	H	H	Н	C ₈ H ₅	CeHs	H_2	H_2
450	6-NO ₂	H	H	Н	CeHs	CeHs	H_2	H_2
451	6-CN	H	H	Н	CaHs	CeHs	H_2	H ₂
452	6-NHCOCH ₃	H	H	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	H_2
453	6-NHCOC & H 5	Н	Н	H	CeH5	C ₆ H ₅	H ₂	H2

	R¹	R²	R³	R4	R ⁵	R e	Х	Y
454	6-SCH₃	H	H	Н	CeH5	CeH5	H ₂	H ₂
455	6-SC ₂ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	H_2	H2
456	6-SCH(CH ₃) ₂	H	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	H_2	H_2
457	6-SO ₂ CH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	H ₂
458	6-S02C2H5	H	H	H	C.H.	C ₆ H ₅	H_2	H ₂
459	6-S0 ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	H_2	H_2
460	6-SC _e H ₅	Н	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	H_2	H_2
461	6-SCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	CeHs	CeHs	H_2	H_2
462	6-NHSO2CH3	H	H	Н	C.H.	C ₆ H ₅	H ₂	H_2
463	6-NHSO ₂ C ₂ H ₅	H	IF.	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	H_2
464	6-NHSO ₂ C ₆ H ₅	H	H	H .	CeH5	C ₆ H ₅	H_2	H_2
465	6-C00H	H	H .	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	H ₂
466	6-C00CH₃	H	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	H_2	H_2
467	6-C00C ₂ H ₅	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	H ₂ .	H_2
468	6-C00CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	, H	CeH5	C ₆ H ₅	H_2	H_2
469	6-N(CH ₃) ₂	H	H	H	CeH5	CoHo	H_2	H_2
470	6-NHCH3	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	H_2
471	6-NH(C ₂ H ₅) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	H_2
472	6-CONH ₂	H	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	H_2	H_2
473	6-CONHCH3	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	H_2
474	6-CON(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	H_2
475	6-OCONHCH ₃	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	H_2
476	6-0C0N(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	H_2
477	6-OCONHCH2C6H5	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	H_2
478	6-OCSNHCH₃	H	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	H ₂	H_2
479	6-0CSN(CH ₃) ₂	H	H	H	CeH5	CeH5	H ₂	H ₂

	R ¹	R²	R³	R4	R ⁵	R ^e	X	Υ
480	6-OCSNHCH2C6H5	Н	Н	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	H ₂	H ₂
481	6-SO2NHCH3	Н	H	H	C ₆ H ₅	C 6 H 5	H_2	H_2
482	6-S0 ₂ N(CH ₃) ₂	Н	H	Н	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	H_2
483	6-SO2NHC2H5	H	H	Н	СеНъ	CeHs	H_2	H_2
484	6-SO ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	H	H	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	H ₂	H ₂
485	6-SO2NHC6H5	Н	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	H_2
486	6-CF ₃	Н	H	Н	CeH5	C ₆ H ₅	H_2	H_2
487	H	CH3	CH ₃	H	C 6 H 5	CeHs	H_2	H ₂
488	5-C1	CH3	CH₃	Н	CeHs	CeHs	H_2	H_2
489	5-Br	CH3	CH₃	Н	C ₆ H ₅	C e H 5	H_2	H_2
490	5-F	СНз	CH ₃	H ·	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	H2
491	5-CH ₃	CH3	CH ₃	H	СеНь	C ₆ H ₅	H_2	H_2
492	5-C ₂ H ₅	CH3	CH ₃	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	H_2	H_2
493	5-CH2CH2CH3	CH ₃	CH₃	H	CeHs	C 6 H 5	H ₂	H_2
494	5-CH(CH ₃) ₂	CH3	CH₃	H	C ₆ H ₅	CeHs	H ₂	H ₂
495	5-CH ₂ C ₆ H ₅	CH3	CH₃	Н	CeHs	CeHs	H_2	H ₂
496	5-0CH ₃	CH ₃	CH3	H	C ₆ H ₅	CeH5	H2	H ₂
497	5-0C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	Н	C 6 H 5	C ₆ H ₅	H 2	H ₂
498	5-0CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	CH3	Н	C 6 H 5	CeHs	H2	H_2
499	5-0C 6 H 5	CH3	CH₃	Н	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	H2
500	5-COCH ₃	CH ₃	CH 3	Н	C 6 H 5	CeHs	H_2	H_2
501	5-0C0CH ₃	CH ₃	CH3	Н	C 6 H 5	CeH5	H_2	H_2
502	5-0H	CH3	CH3	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	H_2	H_2
503	5-NH ₂	CH ₃	CH3	Н	C & H 5	C ₆ H ₅	H_2	H ₂
504	5-NO ₂	CH ₃	CH ₃	H	CeHs	C 6 H 5	H ₂	H ₂

	R ¹	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R ^e .	X	Y
505	5-CN	СН₃	СНз	Н	C ₆ H ₅	CeHs	H ₂	H ₂
506	5-NHCOC 6H 5	CH ₃	CH3	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	H ₂
507	5-SCH₃	CH ₃	CH ₃	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	H_2
508	5-SC ₂ H ₅	CH ₃	CH3	H	CeHs	CeHs	H_2	H_2
509	5-SCH(CH ₃) ₂	CH3	CH₃	H	СеНь	CeHs	H_2	H ₂
510	5-S0 ₂ CH ₃	CH3	CH3	H	CeHs	CeHs	H_2	H_2
511	5-S0 ₂ C ₂ H ₅	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	H_2
512	5-S0 ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH3	. Н	CeHs	CeHs	H ₂	H_2
513	5-SC eHs	CH3	CH3	H	CeHs	CeH5	H_2	H_2
514	5-SCH2CeH5	CH3	€H3	H	CeH5	CeHs	H_2	H_2
515	5-NHSO2CH2	CH ₃	CH ₃	H	CaHs	CeHs	H_2	H_2
516	5-NHSO ₂ C ₂ H ₅	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	H_2
517	5-NHSO ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	CH3	H	CeH5	CeHs	H_2	H_2
518	5-C00H	CH ₃	CH ₃	H	CeHs	CeHs	H_2	H_2
519	5-C00CH3	CH3	CH₃	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	H_2
520	5-C00C ₂ H ₅	CH ₃	CH3	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	H_2
521	5-C00CH2C6H5	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	CeH5	H_2	H_2
522	5-N(CH ₃) ₂	CH3	CH3	H	CeHs	CeHs	H_2	H_2
523	5-NHCH₃	CH3	CH3	H	CeHs	CeHs	H_2	H ₂
524	5-NH(C ₂ H ₅) ₂	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	H_2
525	5-CONH ₂	CH3	CH₃	H	C ₆ H ₅	C & H 5	H ₂	H ₂
526	5-CONHCH3	CH3	CH3	H	CeHs	CeH5	H ₂	H_2
527	5-CON(CH ₃) ₂	CH3	СН₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	H_2
528	5-OCONHCH3	CH ₃	CH₃	H	CeHs	C.H.	H_2	H_2
529	5-0CON(CH ₃) ₂	CH3	CH₃	H	C ₈ H ₅	C.H.	H_2	H ₂
530	5-OCONHCH2C6H5	CH ₃	CH ₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	<u>H2</u>

	R¹	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Х	Y
531	5-OCSNHCH₃	СНз	СН₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H2	H_2
532	5-0CSN(CH ₃) ₂	CH3	CH₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	H_2
533	5-OCSNHCH2C6H5	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	C 6 H 5	H ₂	H_2
534	5-SO2NHCH3	CH3	CH₃	Н	CeH5	C ₆ H ₅	H_2	H_2
535	5-S0 ₂ N(CH ₃) ₂	CH3	CH₃	Н	CeHs	CeHs	H_2	H ₂
536	5-S02NHC2H5	CH3	CH ₃	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	H_2
537	5-S0 ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	CH3	CH₃	H	CeHs	CeHs	H_2	H ₂
538	5-S02NHC6H5	CH3	CH ₃	Н	СвНь	CeHs	H_2	H ₂
539	5-CF ₃	CH3	CH ₃	Н	C ₆ H ₅	CeHs	H ₂	H ₂
540	4-C1	CH ₃	CH₃	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	Н ₂	H ₂
541	4-Br	CH ₃	CH ₃	Н	CeHs	CeHs	H_2	H_2
542	4-F	CH ₃	CH ₃	Н	CeHs	C & H 5	H_2	H_2
543	4-CH ₃	CH ₃	CH ₃	Н	CeHs	CeHs	H2	H_2
544	4-C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	Н	C ₆ H ₅	CeHs	H2	H_2
545	4-CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	Н	C ₈ H ₅	CeH5	H_2	H_2
546	4-CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃	H	CeHs	C 8 H 5	H_2	H_2
547	4-0CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	H_2
548	4-0C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	H_2
549	4-0CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	H_2
550	4-0C 6 H 5	CH ₈	CH₃	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	H_2
551	4-COCH ₃	CH3	CH₃	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	H ₂	H_2
552	4-0COCH₃	CH3	CH₃	H	C 8 H 5	C ₆ H ₅	H2	H_2
553	4-0H	CH3	CH₃	H	C 6 H 5	CeH5	H2	H_2
554	4-NH ₂	CH3	CH ₃	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	H_2
555	4-N0 ₂	CH ₃	CH₃	Н	CeHs	C & H 5	H ₂	H ₂

	R ¹	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R €	X	Y
556	4-CN	CH3	CH3	H	CeH5	C ₆ H ₅	H ₂	H ₂
557	4-NHCOCH3	CH3	CH3	H	CeHs	СвНъ	H ₂	H_2
558	4-NHCOC ₆ H ₅	CH ₃	CH3	H	C.H.	CeHs	H_2	H_2
559	4-SCH ₃	CH₃	CH3	H	CeHs	CeH5	H_2	H_2
560	4-SC2H5	CH ₃	CH3	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	H_2
561	4-CH2CH2CH3	CH₃	CH3	H	CeH5	CeHs	H_2	H_2
562	4-SCH(CH ₃) ₂	CH3	CH3	H	CeHs	CeHs	H_2	H_2
563	4-S0 ₂ CH ₃	CH3	CH3	H	CeHs	CeHs	H_2	H ₂
564	4-S0 ₂ C ₂ H ₅	CH ₃	CH3	. Н	CeHs	CeHs	H_2	H_2
565	4-SO ₂ CH(CH ₃) ₂	CH3	CH3	H	CeHs	CeHs	H_2	H ₂
566	4-SC 6 H 5	CH3	CH₃	H	CeHs	CeHs	H_2	H ₂
567	4-SCH ₂ C ₆ H ₅	CH3	CH ₃	H	CeHs	C_6H_5	H_2	H_2
568	4-NHSO2CH3	СНз	CH3	H	CeHs	CeHs	H_2	H ₂
569	4-NHSO ₂ C ₂ H ₅	CH3	CH ₃	H	CeHs	CeHs	H_2	H ₂
570	4-NHSO ₂ C ₆ H ₅	CH3	CH3	H	CsHs	C ₆ H ₅	H_2	H_2
571	4-C00H	CH ₃	CH ₃	H	CeHs	CeHs	H_2	H_2
572	4-C00CH ₃	CH3	CH ₃	H	CeHs	CeH5	H_2	H_2
573	4-C00C ₂ H ₅	CH3	CH3	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	H_2
574	4-COOCH2C6H5	CH3	CH3	H	C_6H_5	C&H5	H_2	H_2
575	4-N(CH ₃) ₂	CH3	CH ₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	H_2
57 6	4-NHCH ₃	CH ₃	CH3	H	CeHs	CeHs	H_2	H_2
577	4-NH(C ₂ H ₅) ₂	CH ₃	CH₃	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	H ₂
578	4-CONH ₂	CH3	CH₃	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	H_2
579	4-CONHCH ₃	СНз	CH₃	H	CoHo	C ₆ H ₅	H ₂	H ₂
580	4-CON(CH ₃) ₂	СНз	CH3	H	CaHs	C ₆ H ₅	H_2	H_2
581	4-OCONHCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	C ₈ H ₅	CeHs	H ₂	H ₂

	R¹	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R ^e	X	Y
582	4-0CON(CH ₃) ₂	СНз	CH ₃	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	H ₂
583	4-0CONHCH ₂ C ₆ H ₅	CH3	CH3	Н	C 6 H 5	CeHs	H_2	H_2
584	4-OCSNHCH3	CH3	CH3	H	CeHs	C 6 H 5	H_2	H_2
585	4-0CSN(CH ₃) ₂	CH3	CH3	Н	C & H 5	CeH5	H_2	H_2
586	4-OCSNHCH ₂ C ₆ H ₅	CH3	CH3	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	H_2
587	4-SO2NHCH3	CH3	CH3	Н	C e H 5	CeHs	H_2	H_2
588	4-S0 ₂ N(CH ₃) ₂	CH3	CH ₃	Н	CeHs	CeHs	H_2	H ₂
589	4-S02NHC2H5	CH3	CH3	Н	CeHs	CeHs	H ₂	H_2
590	4-S0 ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	CHa	CH ₃	Н	CeHs	C 6 H 5	H_2	H_2
591	4-SO2NHC6H5	CH3	CH3	H	CeHs	CeHs	H_2	H_2
592	4-CF ₃	CH ₃	CH3	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	H_2
593	6-C1	CH3	CH3	H	CeHs	CeHs	H_2	H ₂
594	6-Br	CH3	CH3	H	C 6 H 5	CeHs	H_2	H_2
595	6-F	CH3	CH3	H	CeHs	CeHs	H_2	H_2
596	6-CH3	CH3	CH3	H	C 6 H 5	CeHs	H_2	H_2
597	6-C ₂ H ₅	CH3	CH3	H	CeH5	CeH5	H_2	H_2
598	5-SO ₂ CH(CH ₃) ₂	CH3	CH3	H	C 8 H 5	C_6H_5	H_2	H_2
599	6-CH(CH ₃) ₂	CH3	CH3	H	C 6 H 5	CeHs	H_2	H_2
600	6-CH ₂ C ₆ H ₅	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	CaHs	H_2	H_2
601	6-0CH ₃	CH3	CH3	H	C 6 H 5	C & H 5	H_2	H_2
602	6-0C ₂ H ₅	CH3	CH₃	H	C & H 5	CeHs	H_2	H ₂
603	6-0CH ₂ C ₆ H ₅	CH3	CH3	H	C & H 5	C 6 H 5	H_2	H_2
604	6-0C ₆ H ₅	CH3	CH3	Н	C 6 H 5	CeHs	H_2	H ₂
605	6-COCH3	CH3	CH₃	H	CeHs	CeH5	H_2	H ₂
606	6-0COCH ₃	CH3_	CH ₃	Н	C 6 H 5	C ₆ H ₅	H ₂	H 2

	R ¹	R²	R³	R4	R ⁵	R ⁶	X	Y
607	6-0H	CH3	CH₃	H	CeH5	C _e H ₅	H_2	H ₂
608	6-NH ₂	СНз	CH₃	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	H_2
609	6-N0 ₂	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	H ₂
610	6-CN	CH₃	CH3	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	H ₂
611	6-NHCOCH ₃	CH3	CH3	H	CeHs	CeHs	H_2	H ₂
612	6-NHCOC ₆ H ₅	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	CeH5	H_2	H_2
613	6-SCH₃	CH₃	CH3	H	CeH5	CeHs	H_2	H_2
614	6-SC ₂ H ₅	CH3	CH3	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	H_2
615	6-SCH(CH ₃) ₂	CH₃	CH₃	H	CeHs	CaHs	H ₂	H_2
616	6-S0 ₂ CH ₃	СНз	CH3	H	CeHs	CeHs	H_2	H_2
617	6-S0 ₂ C ₂ H ₅	CH3	CH ₃	H	C ₆ H ₅	CeHs	H ₂	H_2
618	6-S0 ₂ CH(CH ₃) ₂	CHa	CH3	H	C _e H ₅	CeH5	H_2	H_2
619	6-SC ₆ H ₅	CH₃	CH ₃	н .	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	H_2
620	6-SCH ₂ C ₆ H ₅	CHs	CH ₃	H	CeHs	CeHs	H_2	H ₂
621	6-NHSO2CH3	CH3	CH ₃	H	CeHs	CeH5	H_2	H_2
622	6-NHSO ₂ C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	H	C 6 H 5	CeHs	H_2	H_2
623	6-NHSO ₂ C ₆ H ₅	CH₃	CH3	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	H_2	H ₂
624	6-COOH	CH3	CH₃	H	C ₆ H ₅	CeH5	H_2	H ₂
625	6-C00CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	H ₂
626	6-C00C ₂ H ₅	CH3	CH ₃	H	CaHs	CeHs	H_2	H ₂
627	6-COOCH2C6H5	CH ₃	CH₃	H	C ₆ H ₅	CeHs	H_2	H ₂
628	6-N(CH ₃) ₂	CH ₃	CH3	H	C 6 H 5	CeHs	H_2	H ₂
629	6-NHCH₃	CH3	CH ₃	H	C6H5	C ₆ H ₅	H_2	H ₂
630	6-NH(C ₂ H ₅) ₂	CH3	СНз	H	CeHs	C ₆ H ₅	H_2	H2
631	6-CONH ₂	CH3	CH₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	H ₂
632	6-CONHCH ₃	CH3_	CH₃	Н	CaH5	CeH5	H2_	H ₂

	R¹	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R ^e	X	Y
633	6-CON(CH ₃) ₂	СНз	CH3	H	C ₆ H ₅	CeHs	H ₂	H ₂
634	6-OCONHCH ₃	CH3	CH3	H	C 6 H 5	C 6 H 5	H2	H_2
635	6-0C0N(CH ₃) ₂	CH3	CH3	H	CeHs	CeHs	H_2	H_2
636	6-OCONHCH ₂ C ₆ H ₅	CH3	CH3	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	H2
637	6-OCSNHCH ₃	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	CaHs	H_2	H ₂
638	6-OCSN(CH ₃) ₂	CH3	CH3	H	C _e H ₅	C ₆ H ₅	H_2	H_2
639	6-OCSNHCH2C6H5	CH3	CH3	Н	CeHs	CeHs	H_2	H_2
640	6-SO ₂ NHCH ₈	CH3	CH ₃	Н	CeHs	CeHs	H ₂	H ₂
641	6-SO ₂ N(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	H	CeHs	CeHs	H_2	H ₂
642	6-SO ₂ NHC ₂ H ₅	CH₃	CH3	H	СеНь	CeH5	H_2	H_2
643	6-SO ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	CH3	СНз	H	CeHs	C ₆ H ₅	H ₂ .	H_2
644	6-SO ₂ NHC ₆ H ₅	CH ₃	CH3	H	C ₆ H ₅	CeHs	H 2	H_2
645	6-CF ₃	CH ₃	СН₃	H	CeHs	CeH5	H ₂	H ₂
646	5-SCH ₃	CH ₃	H	Н	CeHs	CaHs	H ₂	H ₂
347	5-SC ₂ H ₅	CH3	H	H	CeHs	CaHs	H_2	H_2
348	5-SCH(CH ₃) ₂	СНз	H	H	C_6H_5	CaHs	H_2	H_2
349	5-S0 ₂ CH ₃	CH ₃	H	H	CeHs	C 6 H 5	H_2	H_2
50	5-S0 ₂ C ₂ H ₅	CH3	H	H	CeHs	C_6H_5	H_2	H_2
51	5-S0 ₂ CH(CH ₃) ₂	CH3	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H_2	H ₂
52·	5-SC ₆ H ₅	CH3	H	H	C 6 H 5	CeHs	H_2	H ₂
53	5-CF ₃	CH3	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	H ₂	H2

$$R^{1} \xrightarrow{N} X$$

$$R^{2} \xrightarrow{N} R^{3}$$

$$R^{4} \xrightarrow{R^{5}}$$

No.	R¹	R ²	R³	R ⁴	R ⁵	R ^e	R ⁷	Х	Y
654	5-C1	H	Н	Н	C ₅ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	H ₂	0
655	5-Br	H	H .	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH ₃	H ₂	0
656	5-F	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	0
657	5-CH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	. 0
658	5-C ₂ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	0
659	5-CH2CH2CH3	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	0
660	5-CH(CH ₃) ₂	H	H	H	C.H.	CeHs	CH₃	H_2	0
661	5-CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H_2	0
662	5-0CH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH₃	H_2	0
663	5-0C ₂ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH₃	H ₂	0
664	5-0CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	0
665	5-0C ₆ H ₅	H	H	H	CeH5	CeH5	CH₃	H ₂	0
666	5-COCH ₃	H	H	H	C.H.	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	0
667	5-0COCH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH₃	H_2	0
668	5-0H	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	0
669	5-NH ₂	H	H	H	C _e H _s	CeH5	CH₃	H_2	0
670	5-N0 ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH₃	H_2	0
671	5-CN	Н	H	H	CeHs	CeH5	CH₃	H_2	0
672	5-NHCOCH ₃	H	<u>H_</u>	Н	C ₆ H ₅	C.H.	CH3	<u>H2</u>	0_

No.	R¹	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	Х	Y
673	5-NHCOC eHs	Н	H	Н	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH ₃	H ₂	0
674	5-SCH ₃	H	H	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	H ₂	0
675	5-SC ₂ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	0
676	5-SCH(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	H_2	0
677	5-S0 ₂ CH ₃	H	H	H	CeHs	СеНь	CH₃	H_2	0
678	5-S0 ₂ C ₂ H ₅	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	0
679	5-SO ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	0
680	5-SC _e H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	0
681	5-SCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	Н	CeH5	C ₆ H ₅	CH3	H_2	Ó
682	5-NHSO ₂ CH ₃	H	H .	H	CeHs	CeH5	CH₃	H_2	0
683	5-NHS0 ₂ C ₂ H ₅	H	H	H	CeHs	C 6 H 5	CH3	H_2	0
684	5-NHSO ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	CeHs	CeH5	CH ₃	H ₂	0
685	5-C00H	H	H	H	C 6 H 5	CeHs	CH ₃	H ₂	0
686	5-C00CH ₃	H	H	H	CeHs	CeHs	CH3	H ₂	0
687	5-C00C ₂ H ₅	H	H	H	CeHs	СеНь	CH ₃	H ₂	0
688	5-COOCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C & H 5	C & H 5	CH ₃	H2	0
689	5-N(CH ₃) ₂	H	H	H	CeHs	CeHs	CH3	H ₂	0
690	5-NHCH ₃	H	H	H	CeHs	CeHs	CH3	H ₂	0
691	5-NH(C ₂ H ₅) ₂	H	H	H	CeHs	СеНь	CH3	H2	0
692	5-CONH ₂	H	H	H	CeHs	C 6 H 5	CH ₃	H_2	0
693	5-CONHCH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	C 6 H 5	CH3	H_2	0
694	5-CON(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C & H 5	CH3	H_2	0
695	5-OCONHCH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H_2	0
696	5-0CON(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	0
697	5-OCONHCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH ₃	H_2	0
698	5-OCSNHCH ₃	Н	Н	Н	CeHs	C & H 5	CH3	H ₂	0

No.	R ¹	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R ^e	R ⁷	X	Y
699	5-0CSN(CH ₃) ₂	Н	Н	Н	CeHs	CeHs	СН₃	H ₂	0
700	5-OCSNHCH2C6H5	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH₃	H_2	0
701	5-SO2NHCH8	Н	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	СН₃	H_2	0
702	5-S0 ₂ N(CH ₃) ₂	H	H	H	C _e H _s	СеНБ	CH₃	H_2	0
703	5-SO2NHC2H5	H	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH3	H_2	0
704	5-S0 ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	H	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	0
705	5-SO2NHC6H5	H	H	H	C ₆ H ₅	СеНь	CH ₃	H_2	0
706	5-CF ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	0
				•		•			
707	7-C1	H	H .	H	CeHs	СеНъ	CH ₃	H_2	0
708	7-Br	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	H_2	0
709	7-F	H	H	H	C ₈ H ₅	CeHs	CH ₃	H_2	0
710	7-CH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH ₃	H_2	0
711	7-C ₂ H ₅	H	H	Ħ	CeHs	CeH5	CH ₃	H ₂	0
712	7-CH(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH ₃	H_2	0
713	7-CH2C6H5	H.	H	H	CeHs	CeHs	CH ₃	H_2	0
714	7-0CH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH ₃	H ₂	0
715	7-0C ₂ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H ₂	0
716	7-0CH ₂ C ₅ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH ₃	H_2	0
717	7-0C ₆ H ₅	H	H	H	C ₈ H ₅	CeHs	CH3	H ₂	0
718	7-COCH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH ₃	H_2	0
719	7-0C0CH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	H_2	0
720	7-0H	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	H_2	0
721	7-NH ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H_2	0
722	7-N0 ₂	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	H ₂	0
723	7-CN	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	H ₂	0

No.	R¹	R²	R³	R ⁴	R⁵	R ⁶	R ⁷	Х	Y
724	7-NHCOCH ₃	H	H	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	СНз	H ₂	0
725	7-NHCOC 6H 5	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H_2	0
726	7-SCH₃	H	H	Н	CeH5	C ₆ H ₅	CH3	H_2	0
727	7-SC ₂ H ₅	Н	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH₃	H ₂	0
728	7-CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	H ₂	. 0
729	7-SCH(CH ₃) ₂	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	H ₂	0
730	7-S0 ₂ CH ₃	H	H	H	CeHs	CeH5	CH3	H_2	0
731	7-S0 ₂ C ₂ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	H_2	0
732	7-S0 ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	H ₂	0
733	7-SC 6 H 5	H	H ·	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH ₃	H ₂	0
734	7-SCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	CeHs	CeHs	CH3	H ₂	0
735	7-NHSO ₂ CH ₃	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	H ₂	0
736	7-NHSO ₂ C ₂ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H ₂	0
737	7-NHSO ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C ₈ H ₅	CaHs	CH3	H 2	0
738	7-COOH	H	H	H	C 6 H 5	C 6 H 5	CH ₃	H ₂	0
739	7-C00CH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	H_2	0
740	7-C00C ₂ H ₅	H	H	H	CeHs	CeHs	CH3	H 2	0
741	7-C00CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	CeHs	CeHs	CH3	H_2	0
742	7-N(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	СвНь	CH3	H_2	0
743	7-NHCH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	H ₂	0
744	7-NH(C ₂ H ₅) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH 3	H ₂	0
745	7-CONH ₂	H	H	H	C 6 H 5	C 6 H 5	CH3	H ₂	0
746	7-CONHCH ₃	Н	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH ₃	H ₂	0
747	7-CON(CH ₃) ₂	H	Н	H	CeH5	CeH5	CH₃	H ₂	0
748	7-OCONHCH ₃	H	H	H	C_6H_5	C ₆ H ₅	CH3	H_2	0
749	7-0C0N(CH ₃) ₂	Н	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH ₃	H ₂	0

No.	R¹	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R ^e	R ⁷	Х	Y
750	7-OCONHCH2C6H5	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH₃	H ₂	0
751	7-OCSNHCH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H_2	0
752	7-0CSN(CH ₃) ₂	H	H	H	CeH5	CeHs	CH3	H_2	0
753	7-OCSNHCH2C6H5	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH₃	H_2	0
754	7-SO2NHCH3	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH3	H_2	0
755	7-S0 ₂ N(CH ₃) ₂	Н	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH₃	H_2	0
756	7-S02NHC2H5	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	H_2	0
757	7-S0 ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH ₃	H_2	0
758	7-SO2NHC6H5	H	H	H .	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	СНз	H2	0
7 59	7-CF _s	H	H.	H	CeH5	CeHs	CH3	H_2	0
760	6-C1	H	H	H	C ₆ H ₅	C _s H ₅	CH3	H ₂	0
761	6-Br	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH3	H ₂	0
762	6-F	H	Н	H	C ₆ H ₅	CeHs	СНз	H ₂	0
763	6-CH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	H ₂	0
764	6-C ₂ H ₅	·H	H	Н	C ₆ H ₅	CeHs	CH₃	H ₂	0
765	6-S0 ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	H	C _e H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	H ₂	0
766	6-CH(CH ₃) ₂	Н	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H_2	0
767	6-CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH₃	H_2	0
768	6-0CH3	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	H ₂	0
769	6-0C ₂ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H ₂	0
770	6-OCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₈ H ₅	CH₃	H_2	0
771	6-0CeHs	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH3	H ₂	0
772	6-COCH₃	H	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH3	H ₂	0
773	6-OCOCH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	H ₂	0
774	6-0H	H	Н	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H ₂	0

No.	R¹	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	Х	Y
775	6-NH ₂	Н	H	H	C 6 H 5	C 8 H 5	CH₃	H ₂	0
776	6-N0 ₂	H	H	H	C 6 H 5	C 6 H 5	СН₃	H2	0
777	6-CN	H	H	H	C ₈ H ₅	C & H 5	CH3	H_2	0
778	6-NHCOCH ₃	H	H	H	C&H5	C ₆ H ₅	CH3	H_2	0
779	6-NHCOC 6 H 5	H	H	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	СНз	H_2	0
780	6-SCH₃	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	0
781	6-SC ₂ H ₅	H	H	Н	CeH5	CeHs	CH₃	H_2	0
782	6-SCH(CH ₃) ₂	H	H	Н .	C & H 5	CeHs	CH₃	H_2	0
783	6-S0 ₂ CH ₃	H	H	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	Ó
784	6-S0 ₂ C ₂ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	0
785	6-S0 ₂ CH(CH ₃) ₂	Н	H	Н	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	0
786	6-SC ₆ H ₅	H	H	H	C 8 H 5	CeHs	CH₃	H_2	0 .
787	6-SCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	CaHs	C ₆ H ₅	CH₃	H ₂	0
788	6-NHSO ₂ CH ₃	H	H	H	C ₈ H ₅	CeHs	CH3	H_2	0
789	6-NHSO ₂ C ₂ H ₅	H .	H	H	CeHs	СвНъ	CH₃	H_2	0
790	6-NHSO ₂ C ₈ H ₅	H	H	Н	$C_{\mathfrak{G}}H_{\mathfrak{D}}$	СвНь	CH3	H ₂	0
791	6-C00H	H	H	H	C 6 H 5	СвНб	CH₃	H_2	0
792	6-C00CH ₃	H	H	H	C 8 H 5	C 8 H 5	CH₃	H_2	0
793	6-C00C ₂ H ₅	H	H	H	C 6 H 5	CeHs	CH₃	H ₂	0
794	6-C00CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C 8 H 5	C & H 5	CH3	H ₂	0
795	6-N(CH ₃) ₂	H	H	H	C_8H_5	C 6 H 5	CH₃	H_2	0
796	6-NHCH ₃	H	H	H	C 6 H 5	C 6 H 5	CH₃	H ₂	0
797	6-NH(C ₂ H ₅) ₂	H	H	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH₃	H ₂	0
798	6-CONH ₂	H	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH ₃	H_2	0
799	6-CONHCH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H ₂	0
800	6-CON(CH ₃) ₂	H	Н	Н	C & H 5	C & H 5	CH ₃	H ₂	0

No.	. R ¹	R²	R³	R4	R ⁵	Re	R ⁷	X	Y
801	6-0CONHCH ₃	Н	H	Н	C ₆ H ₅	CeH5	CH ₃	H_2	0
802	6-0CON(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH₃	H_2	0
803	6-OCONHCH2C6H	ls H	H	H	CeH5	CeHs	CH₃	H_2	0
804	6-OCSNHCH₃	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH₃	H_2	0
805	6-0CSN(CH ₃) ₂	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	0
806	6-OCSNHCH2C6H	ls H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H ₂	0
807	6-SO2NHCH3	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H_2	0
808	6-SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH ₃	H_2	0
809	6-SO2NHC2H5	. Н	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH ₃	H_2	0 -
810	6-SO ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	Н	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	0
811	6-SO2NHC6H5	H	H	H	CeHs	CeHs	CH ₃	H_2	0
812	6-CF ₃	Н	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H_2	0
813	6-C1	CH₃	CH₃	H	C ₆ H ₅	C e H s	CH3	H ₂	0
814	6-Br	CH3	CH₃	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	H ₂	0
815	6-F	CH3	CH₃	H	CeHs	CeHs	CH3	H_2	0
816	6-CH ₃	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH3	H_2	0
817	6-C ₂ H ₅	CH3	CH₃	H	CeHs	CeH5	CH3	H_2	0
818	6-S0 ₂ CH(CH ₃) ₂	CH3	CH ₃	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH3	H_2	0
819	6-CH(CH ₃) ₂	CH3	CH3	H	CeHs	CeHs	CH3	H_2	0
820	6-CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₈	CH3	H	CeHs	CeH5	CH3	H_2	0
821	6-0CH ₃	CH3	CH ₃	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	H_2	0
822	6-0C ₂ H ₅	CH3	CH ₃	H	CeHs	C ₈ H ₅	CH₃	H ₂	0
823	6-0CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	CH3	H	CeHe	C ₆ H ₅	CH ₃	H ₂	0
824	6-0C ₆ H ₅	CH3	CH3	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	H ₂	0
825	6-COCH ₃	CH3	CH3	H	СвНь	C ₆ H ₅	СНз	H ₂	0

No.	R¹	R²	R³	R ⁴	R 5	R ⁶	R ⁷	Х	Y
826	6-0COCH₃	CH3	CH₃	Н	C ₆ H ₅	C 6 H 5	CH3	H ₂	0
827	6-0H	CH ₃	CH ₃	H	C 6 H 5	CeHs	CH3	H 2	0
828	6-NH ₂	CH ₃	CH3	Н	C 6 H 5	C ₆ H ₅	СНз	H 2	0
829	6-N0 ₂	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	CeHs	СНз	H_2	0
830	6-CN	CH3	CH3	Н	C 8 H 5	CeHs	CH ₃	H_2	0
831	6-NHCOCH₃	CH3	CH3	H	C 6 H 5	C 6 H 5	CH ₃	H_2	0
832	6-NHCOC 6H 5	CH 3	CH3	H	CaHs	CeH5	CH₃	H_2	0
833	6-SCH ₃	CH ₃	CH3	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH₃	H_{2}	.0
834	6-SC ₂ H ₅	CH3	CH ₃	H	C & H 5	C ₆ H ₅	CH ₃	H ₂	0
835	6-SCH(CH ₃) ₂	CH3	CH3	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	0
836	6-S0 ₂ CH ₃	CH₃	CH3	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H ₂	0
837	6-S0 ₂ C ₂ H ₅	CH₃	CH3	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	H_2	0
838	6-SO ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH3	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH₃	H ₂	0 -
839	6-SC ₆ H ₅	CH3	CH3	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	СНз	H ₂	0
840	6-SCH ₂ C ₆ H ₅	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	H_2	0
841	6-NHSO ₂ CH ₃	СНз	CH₃	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H ₂	0
842	6-NHSO ₂ C ₂ H ₅	CH3	CH3	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH ₃	H ₂	0
843	6-NHSO ₂ C ₆ H ₅	СНз	CH₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H_2	0
844	6-C00H	СНз	CH ₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H_2	0
845	6-C00CH ₃	СНз	CH ₃	H	CeHs	C6H5	CH₃	H_2	0
846	6-C00C ₂ H ₅	CH3	CH ₃	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH₃	H_2	0
847	6-COOCH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	CH3	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	СН₃	H_2	0
848	6-N(CH ₃) ₂	CH3	CH ₃	H	C_6H_5	CeHs	CH₃	H ₂	0
849	6-NHCH ₃	CH3	CH3	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH ₃	H_2	0
850	$6-NH(C_2H_5)_2$	CH3	CH ₃	H	C_6H_5	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	0
851	6-CONH ₂	CH ₃	CH3	Н	CeHs	C & H 5	CH₃	H ₂	0

No.	R ¹	R ²	R³	R ⁴	R⁵	R ^e	R ⁷	X	Y
852	6-CONHCH3	CH₃	CH ₃	Н	CeHs	CeH5	CH ₃	H ₂	0
853	6-CON(CH ₃) ₂	CH₃	CH₃	H	CeHs	CeHs	CH₃	H ₂	0
854	6-OCONHCH3	CH3	CH₃	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH₃	H2	0
855	6-0CON(CH ₃) ₂	CH₃	CH ₃	H	CeHs	C ₈ H ₅	CH ₃	H ₂	0
856	6-OCONHCH2C6H5	CH₃	CH3	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	0
857	6-OCSNHCH3	CH₃	CH₃	H	СеНь	C ₆ H ₅	CH ₃	H ₂	0
858	6-OCSN(CH ₈) ₂	CH₃	CH3	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	0
859	6-OCSNHCH2C6H5	CH ₃	CH₃	H	CeHs	CeHs	CH₃	H_2	0
860	6-SO2NHCH3	CH₃	CH3	H.	CaH5	C ₆ H ₅	СНз	H ₂	. 0
861	6-SO ₂ N(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	H	CeHs	CeH5	CH₃	H ₂	0
862	6-S02NHC2H5	CH ₃	CH ₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	0
863	6-SO ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	CH3	CH ₃	H	C & H 5	CeH5	CH3	H ₂	0
864	6-SO2NHCeH5	CH3	CH ₃	H	CeH5	CeH5	CH3	H ₂	0
865	6-CF ₃	CH3	CH ₃	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	0
866	5-C1	H	Н	. Н	CeH5	C ₆ H ₅	CH₃	H ₂	H_2
867	5-Br	Н	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	СН₃	H_2	H ₂
868	5-F	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	H_2	H ₂
869	5-CH₃	H	H	H	CeHs	C ₈ H ₅	CH₃	H_2	H_2
870	5-C ₂ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H ₂	H_2
871	5-CH2CH2CH3	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	H_2	H_2
872	5-CH(CH ₃) ₂	Н	H	H	C ₆ H ₅	C.H.	CH ₃	H_2	H_2
873	5-CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH ₃	H_2	H ₂
874	5-0CH₃	Н	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	H_2	H_2
875	5-0C ₂ H ₅	H	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH ₃	H_2	H_2
876	5-0CH ₂ C ₆ H ₅	H	Н	H	CeH5_	CeHs	CH3	H ₂	H ₂

- No	R¹	R²	R ³	R4	R ⁵	R ⁶	R ⁷	X	Y
No.	Λ	<u></u>			Λ	<u>n</u>	n		
877	5-0C ₆ H ₅	Н	H	Н	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	H_2	H_2
878	5-COCH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH₃	H_2	H_2
879	5-0C0CH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	H_2
880	5-0H	H	H	H	C_6H_5	C 6 H 5	СНз	H2	H_2
881	. 5-NH ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	СНз	H_2	H_2
882	5-N0 ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C 8 H 5	CH ₃	H_2	H_2
883	5-CN	H	H	H	C.H.	CeH5	CH3	H ₂	H ₂
884	5-NHCOCH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	CoHo	CH3	H2	H ₂
885	5-NHCOC 6 H 5	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H_2	H_2
886	5-SCH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H ₂ .	H_2
887	5-SC ₂ H ₅	H	H	H	C 6 H 5	C 6 H 5	CH ₃	H_2	H ₂
888	5-SCH(CH ₃) ₂	H	H	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	СН₃	H2	H ₂
889	5-S0 ₂ CH ₃	H	H	H	C & H 5	C 6 H 5	CH3	H_2	H_2
890	5-S0 ₂ C ₂ H ₅	H	H	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH3	H_2	H_2
891	5-S0 ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C 6 H 5	CH3	H_2	H ₂
892	5-SC ₆ H ₅	Н	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH3	H_2	H_2
893	5-SCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C_6H_5	C 8 H 5	CH3	H_2	H ₂
894	5-NHSO ₂ CH ₃	H	H	H	C 6 H 5	CaHs	CH₃	H_2	H2
895	5-NHSO ₂ C ₂ H ₅	Н	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	H_2	H ₂
896	5-NHSO ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	H ₂
897	5-COOH	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	H ₂
898	5-C00CH ₃	H	H	H	C 6 H 5	C 6 H 5	CH₃	H_2	H ₂
899	5-C00C ₂ H ₅	H	H	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	H_2
900	5-C00CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	H_2
901	5-N(CH ₃) ₂	Н	${\tt H}_{_}$	H	C ₆ H ₅	C 6 H 5	CH ₃	H ₂	H ₂

No.	R¹	R ²	R³	R4	R ⁵	R ⁶	R ⁷	Х	Y
902	5-NHCH ₃	Н	H	H	C ₆ H ₅	C _e H ₅	CH₃	H ₂	H_2
903	5-NH(C ₂ H ₅) ₂	H	H	Н	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	H_2	H_2
904	5-CONH ₂	H	H	H	CeHs	CeHs	CH 3	H_2	H_2
905	5-CONHCH3	H	H	H	CeHs	СвНб	CH ₃	H ₂	H ₂
906	5-CON(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₈ H ₅	CeHs	CH3	H_2	H_2
907	5-OCONHCH3	H	H	H	C ₆ H ₅	CaHs	CH₃	H_2	H_2
908	5-0C0N(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	H_2	H_2
909	5-0CONHCH2C6H5	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH ₃	H_2	H_2
910	5-OCSNHCH ₃	H	. Н	H	C ₆ H ₅	C 6 H 5	CH ₃	H_2	H ₂
911	5-0CSN(CH ₃) ₂	H	Н	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	H_2	H ₂
912	5-OCSNHCH2C6H5	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	H_2	H_2
913	5-SO2NHCH3	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H_2	H_2
914	5-S0 ₂ N(CH ₃) ₂	H	. Н	H	C ₆ H ₅	C ₅ H ₅	CH3	H_2	H ₂
915	5-S02NHC2H5	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	H_2	H_2
916	5-S0 ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	CaHs	СНз	H_2	H ₂
917	5-SO2NHC6H5	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH ₃	H_2	H ₂
918	5-CF ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	H_2	H ₂
919	7-C1	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH ₃	H_2	H ₂
920	7-Br	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H_2	H ₂
921	7-F	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH ₃	H ₂	H ₂
922	7-CH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H ₂	H ₂
923	7-C ₂ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	H_2	H ₂
924	7-CH(CH ₃) ₂	H	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH3	H_2	H_2
925	7-CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	H ₂
926	7-0CH ₃	H	Н	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH ₃	H2_	H ₂

No.	R¹	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	Х	Y
927	7-0C ₂ H ₅	Н	Н	Н	CeH5	C ₆ H ₅	СНз	H_2	H_2
928	7-0CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	Н	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	H_2	H_2
929	7-0C ₆ H ₅	H	H	Н	C ₆ H ₅	C ₈ H ₅	CH3	H ₂	H_2
930	7-COCH₃	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	H_2	H_2
931	7-0C0CH ₃	Н	H	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H_2	H ₂
932	7-0H	H	H	Н	C ₆ H ₅	C 6 H 5	CH3	H_2	H_2
933	7-NH ₂	Н	H	Н	CaH5	CeHs	CH3	H ₂	H ₂
934	7-N0 ₂	Н	Н	Н .	C ₆ H ₅	CeHs	СНз	H2	H ₂
935	7-CN	H	Н	H	C ₅ H ₅	CeHe	CH3	H2	H_2
936	7-NHCOCH ₃	Н	Н .	H	C ₈ H ₅	CeHs	СНз	H ₂	H_2
937	7-NHCOC 6H5	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H ₂	H_2
938	7-SCH ₃	H	H	Н	C ₆ H ₅	CeH5	СН₃	H_2	H_2
939	7-SC ₂ H ₅	H	H	Ή	C 8 H 5	C ₆ H ₅	CH₃	H ₂	H_2
940	7-CH ₂ CH ₂ CH ₃	Н	H	Н	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	H ₂
941	7-SCH(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	СвНъ	CH3	H_2	H ₂
942	7-S0 ₂ CH ₃	H	H	Н	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	H ₂	H ₂
943	7-S0 ₂ C ₂ H ₅	H	H	Н	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH3	H ₂	H ₂
944	7-S0 ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	Н	C 6 H 5	CeHs	CH3	H_2	H ₂
945	7-SC ₆ H ₅	H	H	Н	C ₆ H ₅	СеНь	CH3	H ₂	H ₂
946	7-SCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	Н	C & H 5	CeHs	СНз	H ₂	H_2
947	7-NHSO2CH3	H	H	H	C 6 H 5	CeHs	CH3	H ₂	H ₂
948	7-NHSO ₂ C ₂ H ₅	H	H	Н	C ₆ H ₅	СвНь	CH3	H ₂	H ₂
949	7-NHSO ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C 8 H 5	C ₈ H ₅	CH ₃	H ₂	H_2
50	7-C00H	H	H	H	C 8 H 5	C ₆ H ₅	CH3	H ₂	H ₂
51	7-C00CH₃	H	H	H	C & H 5	C ₆ H ₅	CH3	H ₂	H ₂
52	7-C00C ₂ H ₅	Н	Н	Н	C ₆ H ₅	CeHs	CH₃	H ₂	H ₂

No.	R¹	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R ^e	R ⁷	X	Y
953	7-C00CH ₂ C ₆ H ₅	Н	Н	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	H ₂	H ₂
954	7-N(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H_2	H_2
955	7-NHCH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H_2	H_2
956	7-NH(C ₂ H ₅) ₂	H	H	Н	C _e H ₅	CeH5	СН₃	H ₂	H ₂
957	7-CONH ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	H_2
958	7-CONHCH3	H	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	H_2
959	7-CON(CH ₃) ₂	H	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	H ₂
960	7-OCONHCH3	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	H ₂
961	7-0CON(CH ₃) ₂	Ĥ	Ĥ	Н	CeH5	C ₆ H ₅	CH3	H_2	H ₂
962	7-OCONHCH2C6H5	H	н .	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH3	H_2	H ₂
963	7-OCSNHCH ₃	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	H ₂ .	H ₂
964	7-0CSN(CH ₃) ₂	H	H	H	CeHs	CeHs	CH₃	H_2	H ₂
965	7-OCSNHCH2C6H5	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H_2	H_2
966	7-SO2NHCH3	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH3	H_2	H_2
967	7-S0 ₂ N(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH₃	H_2	H_2
968	7-SO2NHC2H5	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH3	H_2	H_2
969	7-S0 ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	H_2
970	7-S02NHC6H5	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H_2	H ₂
971	7-CF ₃	H	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	H ₂
972	6-C1	Н	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH3	H_2	H ₂
973	6-Br	H	H	H	CeH5	СеНь	CH₃	H_2	H ₂
974	6-F	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH₃	H_2	H2
975	6-CH3	H	H	H	CeHs	CeH5	CH₃	H_2	H_2
976	6-C ₂ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H_2	H_2
977	6-S0 ₂ CH(CH ₃) ₂	Н	H	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	H ₂	H ₂

No.	R¹	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R e	R ⁷	X	Y
978	6-CH(CH ₃) ₂	Н	H	Н	C & H &	C ₆ H ₅	CH3	H ₂	H ₂
979	6-CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH₃	H_2	H ₂
980	6-0CH3	Н	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	H_2	H_2
981	6-0C ₂ H ₅	H	H	H	C 6 H 5	CaHs	CH3	H2	H_2
982	6-0CH ₂ C ₆ H ₅	H	Н	Н	C e H 5	C ₆ H ₅	CH₃	H ₂	H_2
983	6-0C ₆ H ₅	Н	H	H	C ₆ H ₅	C ₈ H ₅	CH ₃	H ₂	H ₂
984	6-COCH ₃	Н	H	Н	CeHs	СеНь	CH₃	H ₂	H_2
985	6-0C0CH ₃	H.	H	H	C ₆ H ₅	СвНь	CH3	H_2	H ₂
986	6-0H	H	H	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	H ₂
987	6-NH ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	H_2	H2
988	6-N0 ₂	H	H	H	C & H &	CeHs	CH₃	H_2	H_2
989	6-CN	H	Н	H	C 6 H 5	CeHs	CH ₃	H_2	H ₂
990	6-NHCOCH ₃	H	Н	H	CeH5	C 6 H 5	CH3	H ₂	H ₂
991	6-NHCOC 6 H 5	H	H	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH ₃	H ₂	H ₂
992	6-SCH ₃	H	H	H	C 6 H 5	CeHs	CH ₃	H_2	H_2
993	6-SC ₂ H ₅	H	H	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH ₃	H_2	H_2
994	6-SCH(CH ₃) ₂	H	H	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH3	H_2	H_2
995	6-S0 ₂ CH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	H ₂	H ₂
996	6-S0 ₂ C ₂ H ₅	H	H	Н	C 6 H 5	CeHs	CH ₃	H ₂	H_2
997	6-S0 ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH ₃	H_2	H_2
998	6-SC ₆ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH ₃	H ₂	H2
999	6-SCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C_6H_5	CeHs	CH ₃	H_2	H_2
1000	6-NHSO ₂ CH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	H_2	H_2
1001	6-NHSO ₂ C ₂ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	H_2	H_2
1002	6-NHS0 ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	H_2	H_2
1003	6-C00H	Н	H	Н	C 6 H 5	C e H 5	CH₃	H ₂	H ₂

No.	R ¹	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R7	X	Y
004	6-C00CH ₃	Н	Н	Н	C _e H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	H_2	H ₂
.005	6-C00C ₂ H ₅	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	H_2	H ₂
.006	6-C00CH2C6H5	H	H	H	CeH5	CeHs	CH3	H_2	H_2
007	6-N(CH ₃) ₂	H	H	Н	CeHs	CeHs	CH₃	H_2	H_2
.008	6-NHCH ₃	Н	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH₃	H_2	H_2
.009	6-NH(C ₂ H ₅) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH3	H_2	H_2
010	6-CONH ₂	H	H	H	CeHs	CeHs	CH3	H_2	H_2
.011	6-CONHCH ₃	H	H	H	CeHs	CeHs	CH₃	H2	H ₂
012	6-CON(CH ₃) ₂	H	• Н	H	CeH5	CeHs	CH₃	H_2	H ₂
013	6-OCONHCH3	H	Н	H	CeHs	CeHs	CH₃	H_2	H_2
.014	6-0CON(CH ₃) ₂	H	H	Н	CeHs	CeHs	CH3	H_2	H ₂
015	6-OCONHCH2C6H5	H	Н	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H_2	H ₂
016	6-OCSNHCH3	H	Н .	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	H_2
017	6-0CSN(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₈ H ₅	CH ₃	H_2	H ₂
018	6-OCSNHCH2C6H5	Н	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	H_2
019	6-SO2NHCH3	Н	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	H2	H_2
020	6-S0 ₂ N(CH ₃) ₂	H	H	H	CeH5	CeHs	CH₃	H2	H_2
021	6-SO ₂ NHC ₂ H ₅	Н	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH3	H_2	H_2
022	6-S0 ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH₃	H ₂	H_2
023	6-SO2NHC6H5	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH₃	H_2	H_2
024	6-CF ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH₃	H ₂	H_2
INSE	6-C1	CH₃	CH₃	H	C ₆ H ₅	СеНъ	CH₃	H ₂	H ₂
1025		CH ₃	CH ₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	H ₂	H ₂
1026	6-Br	CH ₃	CH ₃	H	C _e H ₅	CeHs	CH ₃	H ₂	H ₂
1027 1028	6-F 6-CH ₃	CH ₃	CH ₃	Н	C ₆ H ₅	C _e H ₅	CH ₃	H ₂	H ₂

No.	R ¹	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	X	Y
1029	6-C ₂ H ₅	CH₃	СН₃	Н	CeHs	C 6 H 5	CH₃	H_2	H2
1030	6-S0 ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH3	H	C 6 H 5	C 6 H 5	CH₃	H_2	H2
1031	6-CH(CH ₃) ₂	CH3	CH3	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	СНз	H_2	H ₂
1032	6-CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	CH3	H	CeHs	CeH5	CH3	H2	H_2
1033	6-0CH ₃	CH3	CH3	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH₃	H ₂	H ₂
1034	6-0C ₂ H ₅	CH ₃	CH3	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	H_2
1035	6-0CH ₂ C ₆ H ₅	CH3	CH3	H	CeHs	C ₆ H ₅	СН₃	H_2	H_2
1036	6-0C ₆ H ₅	CH3	CH ₃	Н	CeHs	C _e H ₅	CH3	H_2	H ₂
1037	6-COCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH₃	H ₂	H_2
1038	6-0C0CH ₃	CH ₃	CH3	Н	CeH5	CeHs	CH₃	Н ₂	H_2
1039	6-0H	CH3	CH₃	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH ₃	H_2	H_2
1040	6-NH ₂	CH3	CH₃	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH ₃	H_2	H ₂
1041	6-N0 ₂	CH3	CH3	H	C 6 H 5	CeHs	CH ₃	H_2	H2
1042	6-CN	CH3	CH3	H	C & H 5	СвНъ	CH3	H ₂	H2
1043	6-NHCOCH₃	CH₃	CH3	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	H ₂	H2
1044	6-NHCOC ₆ H ₅	CH ₃	СНз	H	C 6 H 5	CeHs	CH3	H ₂	H_2
1045	6-SCH₃	CH ₃	СНз	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH ₃	H ₂	H ₂
1046	6-SC ₂ H ₅	CH3	CH3	H	CeHs	C 6 H 5	CH3	H ₂	H ₂
1047	6-SCH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH₃	H	CeHs	CeHs	CH3	H ₂	H_2
1048	6-S0 ₂ CH ₃	CH ₃	СНз	H	C 6 H 5	CeHs	CH₃	H ₂	H_2
1049	6-S0 ₂ C ₂ H ₅	CH3	СНз	H	CeHs	CeHs	CH₃	H ₂	H ₂
1050	6-SO ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH₃	H	CeHs	C & H 5	CH₃	H ₂	H ₂
1051	6-SC ₆ H ₅	CH ₃	CH3	H	C ₈ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H ₂	H ₂
1052	6-SCH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	H ₂	Н₂
1053	6-NHSO ₂ CH ₃	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	CeHo	CH3	H ₂	H ₂
1054	6-NHSO ₂ C ₂ H ₅	CH ₃	CH3	H	СеНь	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	H ₂

No.	R ¹	R ²	R³	R ⁴	R ⁵	R ^e	R7	X	Y
	6-NHSO ₂ C ₆ H ₅	CH₃	СНз	Н	CeHs	C ₆ H ₅	CH₃	H ₂	H ₂
1055 1056	6-COOH	CH ₃	CH ₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H_2	H ₂
1057	6-COOCH ₃	CH ₃	CH ₃	Н	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	H_2	H_2
1058	6-C00C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	H	C ₆ H ₅	CaHs	СНз	H_2	H_2
1059	6-C00CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃	Н	C ₈ H ₅	CeHs	CH₃	H_2	H ₂
1060	6-N(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	H	C _e H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	H_2	H ₂
1061	6-NHCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	C _e H ₅	CeHs	CH ₃	H_2	H ₂
1062	6-NH(C ₂ H ₅) ₂	CH ₃	CH ₃	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH₃	H_2	H ₂
1063	6-CONH ₂	CH ₃	CH ₃	H	C ₆ H ₅	C _e H ₅	СНз	H ₂	H ₂
1064	6-CONHCH ₃	CH ₃	CH3	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH₃	H_2	H ₂
1065	6-CON(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	Н	CeH5	CeHs	CH ₃	H ₂	H_2
1066	6-OCONHCH ₃	CH3	CH ₃	H	C _e H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	H_2	H ₂
1067	6-0CON(CH ₃) ₂	CH ₃	CH3	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH ₃	H_2	H_2
1068	6-OCONHCH2CeH5		CH ₃	H	C _e H ₅	CeHs	CH ₂	H_2	H ₂
1069	6-OCSNHCH ₃	CH ₃	CH₃	H	C _e H _s	C ₆ H ₅	CH₃	H_2	H ₂
1070	6-0CSN(CH ₃) ₂	CH₃	CH ₃	H	CeH5	CeHs	CH₃	H_2	H_2
1071	6-OCSNHCH ₂ C ₆ H ₅		CH₃	H	CeH5	CeH5	CH₃	H_2	H_2
1072	6-SO2NHCH3	CH ₃	CH₃	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH ₃	H2	H ₂
1073	6-S0 ₂ N(CH ₃) ₂	CH ₃		H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	H ₂	H ₂
1074	6-SO2NHC2H5	CH₃	CH ₃	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH ₃	H_2	H_2
1075	6-S0 ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	CH₃	CH3	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	H_2	H ₂
1076	6-SO2NHC6H5	CH₃	CHs	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH3	H_2	H_2
1077	6-CF ₃	CH ₃	CH3	H	CeH5	CeHs	CH ₃	H_2	H_2
_ + • •									
1078	5-C1	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH3	0	0
1079	5- <u>B</u> r	H	Н	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH ₃	0_	0

No.	R¹	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R 6	R ⁷	X	Y
1080	5-F	Н	H	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	0	0
1081	5-CH ₃	H	H	Н	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH₃	, 0	0
1082	5-C ₂ H ₅	H	H	H	C 6 H 5	CeH5	CH3	0	0
1083	5-CH2CH2CH3	. Н	H	H	C_6H_5	C 6 H 5	CH₃	0	0
1084	5-CH(CH ₃) ₂	Н	H	H	CaHs	C 6 H 5	CH₃	0	0
1085	5-CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C 6 H 5	CH₃	0	0
1086	5-0CH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH₃	0	0
1087	5-0C ₂ H ₅	Н	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1088	5-0CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C & H 5	CeHs	CH₃	0	0
1089	5-0C ₆ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	0	0
1090	5-COCH ₃	H	H	H	CeH5	C 6 H 5	CH ₃	0	0
1091	5-0C0CH ₈	Н	H	H	CeHs	C 6 H 5	CH3	0	0
1092	5-0H	Н	H	H	C ₆ H ₅	СеНъ	CH₃	0	0
1093	5-NH ₂	Н	H	H	CeHs	C 6 H 5	CH3	0	0
1094	5-NO ₂	Н	H	H	C ₈ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1095	5-CN	Н	H	H	C 6 H 5	СеНъ	CH3	0	0
1096	5-NHCOCH ₃	H	H	H	C 8 H 5	CeHs	CH₃	0	0
1097	5-NHCOC 6H5	H	H	H	C 8 H 5	C 8 H 5	CH3	0	0
1098	5-SCH ₃	H	H	H	C 8 H 5	C & H &	CH₃	0	0
1099	5-SC ₂ H ₅	Н	H	H	C 6 H 5	СвНь	CH3	0	0
1100	5-SCH(CH ₃) ₂	Н	H	H	C 6 H 5	C_6H_5	CH3	0	0
1101	5-S0 ₂ CH ₃	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH₃	0	0
1102	5-S0 ₂ C ₂ H ₅	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH₃	0	0
1103	5-SO ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C_6H_5	CH ₃	0	0
1104	5-SC ₆ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	0	0
1105	5-SCH ₂ C ₆ H ₅	H	Н	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	0	0

No.	R ¹	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	Х	Y
1106	5-NHSO2CH3	H	Н	Н	CeHs	CeH5	CH₃	0	0
1107	5-NHSO ₂ C ₂ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH3	0	0
1108	5-NHSO2C6H5	H	H	H	C ₆ H ₅	C.H.	CH ₃	0	0
1109	5-C00H	H	H	H	C _e H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1110	5-C00CH3	H	H	H	CeHs	CeH5	CH3	0	0
1111	5-C00C ₂ H ₅	H	H	H	CeHs	CeH5	CH3	0	0
1112	5-C00CH2C6H5	H	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH₃	0	0
1113	5-N(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₈ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1114	5-NHCH₃	H	H	H	CeHs	C.H.	CH₃	0	0
1115	5-NH(C ₂ H ₅) ₂	H	H ·	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH ₃	0	0
1116	5-CONH ₂	H	H	H	C 6 H 5	CeH5	CH3	0	0
1117	5-CONHCH3	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1118	5-CON(CH ₈) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	0	0
1119	5-OCONHCH ₃	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1120	5-0CON(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1121	5-OCONHCH2C6H5	H	H	·H	CeH5	CeHs	CH3	0	0
1122	5-OCSNHCH ₃	Ħ	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	0	0
1123	5-0CSN(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	0	0
1124	5-OCSNHCH2C6H5	H	H	H	C ₆ H ₅	C.H.	CH ₃	0	0
1125	5-SO2NHCH3	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1126	5-S0 ₂ N(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH3	0	0
1127	5-S02NHC2H5	H	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1128	5-S0 ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1129	5-SO2NHC6H5	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1130	5-CF ₃	Н	Н	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃ _	0	0

No.	R¹	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	X	Y
1131	7-CI	Н	Н	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	СН₃	0	0
1132	7-Br	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH₃	0	0
1133	7-F	H	H	H	C 8 H 5	C 8 H 5	CH₃	0	0
1134	7-CH ₃	H	H	H	C_6H_5	C 6 H 5	CH3	0	0
1135	7-C ₂ H ₅	Н	H	H	C ₆ H ₅	C 6 H 5	CH₃	0	0
1136	7-CH(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C 6 H 5	CH₃	0	0
1137	7-CH ₂ C ₆ H ₅	Н	H	Н	CeH5	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1138	7-0CH ₃	Н	H	H _.	C ₈ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1139	7-0C ₂ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH ₃	0	0
1140	7-0CH ₂ C ₆ H ₅	Н	H	H	CeHe	CeHs	CH ₃	0	0
1141	7-0C ₆ H ₅	Н	H	H	CeHs	CeHs	CH ₃	0	0
1142	7-COCH ₃	Н	H	H	C _e H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1143	7-0C0CH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1144	7-0H	H	H	H	C & H 5	CeHs	CH₃	0	0
1145	7-NH ₂	Н	H	H	CeH5	CeHs	CH3	0	0
1146	7-N0 ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH₃	0	0
1147	7-CN	H	H	H	C_6H_5	C ₆ H ₅	CH₃	0	0
1148	7-NHCOCH ₃	H	H	H	CeHs	CeHs	CH3	0	0
1149	7-NHCOC 6 H 5	Н	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1150	7-SCH ₃	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1151	7-SC ₂ H ₅	H	H	H	C 6 H 5	CeHs	CH₃	0	0
1152	7-CH2CH2CH3	H	H	H	C 6 H 5	CeHs	CH3	0	0
1153	7-SCH(CH ₃) ₂	Н	H	H	C 8 H 5	CeHs	CH3	0	0
1154	7-S0 ₂ CH ₃	H	H	H	C 6 H 5	C 6 H 5	CH3	0	0
1155	7-S0 ₂ C ₂ H ₅	H	H	H	CeHs	CeHs	CH₃	0	0
1156	7-S0 ₂ CH(CH ₃) ₂	Н	H	<u> </u>	C ₆ H ₅	CeHs	СН₃	0	0

No.	R ¹	R²	R³	R ⁴	R ^s	R ⁶	R ^τ	Х	Y
1157	7-SC ₆ H ₅		Н	Н	CeHs	CeHs	CH3	0	0
1158	7-SCH2C6H5	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	0	0
1159	7-NHSO2CH3	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1160	7-NHSO ₂ C ₂ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1161	7-NHSO ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	0	0
1162	7-C00H	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	0	0
1163	7-C00CH ₃	H	H	Н	CeH5	CeHs	CH ₃	0	0
1164	7-C00C ₂ H ₅	H	H	Н	C _e H ₅	CeH5	CH3	0	0
1165	7-COOCH2C6H5	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH₃	0	0 -
1166	7-N(CH ₃) ₂	H	Н.	H	C ₆ H ₅	C ₈ H ₅	CH₃	0	0
1167	7-NHCH ₃	Н	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	0	0
1168	7-NH(C ₂ H ₅) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	0	0
1169	7-CONH ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1170	7-CONHCH3	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	0	0
1171	7-CON(CH ₃) ₂	H	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1172	7-0CONHCH3	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH3	0	0 .
1173	7-0CON(CH ₈) ₂	H	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1174	7-OCONHCH2C6H5	H	H	H	CeHs	CeH5	CH3	0	0
1175	7-OCSNHCH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1176	7-0CSN(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH3	0	0
1177	7-OCSNHCH2C6H5	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	0	0
1178	7-SO2NHCH3	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1179	7-SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH3	0	0
1180	7-S02NHC2H5	H	H	H	CeHs	CeH5	CH₃	0	0
1181	7-SO ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH₃	0	0
1182	7-SO ₂ NHC _e H ₅	Н	H	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	00	0

No.	R¹	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	X	Y
1183	7-CF₃	Н	Н	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	0	0
1184	6-C1	H	Н	H	C ₆ H ₅	СеНь	CH₃	0	0
1185	6-Br	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	0	0
1186	6-F	H	H	H	C 6 H 5	CeHs	CH3	0	0
1187	6-CH ₃	H	H	H	CeHs	CeHs	CH3	0	0
1188	6-C ₂ H ₅	H	H	H	CeHs	CeH5	CH3	0	0
1189	6-S0 ₂ CH(CH ₃) ₂	Н	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1190	6-CH(CH ₃) ₂	H	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH ₃	0	0
1191	6-CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	0	0
1192	6-0CH ₃	H	H	H	C 6 H 5	CeHs	CH3	0	0
1193	6-0C ₂ H ₅	H	H	Н	C ₆ H ₅	C 6 H 5	CH ₃	0	0
1194	6-0CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1195	6-0C ₈ H ₅	H	H	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1196	6-COCH ₃	H	H	H	C 6 H 5	CeHs	CH ₃	0	0
1197	6-0C0CH ₃	H	H	H	C ₈ H ₅	CeHs	CH₃	0	0
1198	6-0H	H	H	H	C 6 H 5	C 8 H 5	CH₃	0	0
1199	6-NH ₂	H	H	H	C_6H_5	C 6 H 5	CH₃	0	0
1200	6-N0 ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1201	6-CN	H	H	H	CoHo	C 6 H 5	CH3	0	0
1202	6-NHCOCH₃	H	H	Н	C 8 H 5	C 6 H 5	CH3	0	0
1203	6-NHCOC 6H 5	H	H	H	C 6 H 5	C 6 H 5	CH3	0	0
1204	6-SCH ₃	H	H	Н	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1205	6-SC ₂ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1206	6-SCH(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	СН₃	0	0
1207	6-S0 ₂ CH ₃	H	H	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	0

No.	R¹	R²	R³	R ⁴	R ^s	R ^e	R ⁷	Х	Y
1208	6-S0 ₂ C ₂ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	0	0
1209	6-SO ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	H	CoHs	CeHs	CH3	0	0
1210	6-SC ₆ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH3	0	0
1211	6-SCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C _e H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1212	6-NHSO2CH3	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	0	0
1213	6-NHSO ₂ C ₂ H ₅	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1214	6-NHSO ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH 3	0	0
1215	6-C00H	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₈ H ₅	CH ₃	0	0
1216	6-C00CH ₃	H	H	H	СвНъ	C ₈ H ₅	CH3 .	0	0
1217	6-C00C ₂ H ₅	H	H ·	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1218	6-C00CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	0.	0
1219	6-N(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	0	0
1220	6-NHCH ₃	H	H	H	СеНь	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1221	6-NH(C ₂ H ₅) ₂	H	H	H	CeHB -	C ₆ H ₅	СНз	0	0
1222	6-CONH ₂	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1223	6-CONHCH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH ₃	0	0
1224	6-CON(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH ₃	0	0
1225	6-OCONHCH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1226	6-0CON(CH ₃) ₂	H	H	H	C&H5	CeH5	CH ₃	0	0
1227	6-OCONHCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH ₃	0	0
1228	6-OCSNHCH3	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1229	6-0CSN(CH ₃) ₂	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1230	6-OCSNHCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	0	0
1231	6-S02NHCH3	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	0	0
1232	6-S0 ₂ N(CH ₃) ₂	H	H	H	CeH5	CeHs	CH3	0	0
1233	6-S02NHC2H5	H	H	H	CeH5	CeH5	CH₃_	0	0

No.	R¹	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	Х	Y
1234	6-S0 ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	Н	H	Н	C ₆ H ₅	C 6 H 5	CH₃	0	0
1235	6-S02NHC6H5	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	0	0
1236	6-CF ₃	H	H	H	C _e H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	0	0
1237	6-C1	CH3	CH3	Н	C 6 H 5	C 6 H 5	CH₃	0	0
1238	6-Br	CH3	CH ₃	Н	CeHs	C ₆ H ₅	CH ₃	0	0
1239	6-F	CH3	CH3	H	C _e H ₅	C 6 H 5	CH₃	0	0
1240	6-CH ₃	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	0	0
1241	6-C ₂ H ₅	CH3	CH ₃	H	C 8 H 5	C ₆ H ₅	CH ₃	Ò	0
1242	6-SO ₂ CH(CH ₃) ₂	CH3	СНз	H	C & H 5	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1243	6-CH(CH ₃) ₂	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	C & H 5	CH3	0	0
1244	6-CH ₂ C ₆ H ₅	CH3	CH ₃	H	CeHs	C 6 H 5	CH3	0	0
1245	6-0CH ₃	CH3	CH₃	H	C ₈ H ₅	CeH5	CH3	0	0
1246	6-0C ₂ H ₅	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	СвНб	CH₃	0	0
1247	6-0CH ₂ C ₆ H ₅	CH3	CH3	H	C 8 H 5	C 8 H 5	CH3	0	0
1248	6-0C ₆ H ₅	CH3	CH3	Н	C 6 H 5	C 6 H 5	CH₃	0	0
1249	6-COCH ₈	CH3	CH ₃	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH₃	0	0
1250	6-0C0CH ₃	CH ₃	СHз	H	C ₈ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1251	6-0H	CH ₃	CH3	H	CeHs	C 6 H 5	CH3	0	0
252	6-NH ₂	CH3	CH3	H	CeHs	C & H 5	CH3	0	0
1253	6-N0 ₂	CH ₃	CH₃	H	C ₆ H ₅	C 6 H 5	CH3	0	0
1254	6-CN	CH3	CH3	Н	C ₆ H ₅	CeH5	CH₃	0	0
1255	6-NHCOCH₃	CH3	CH₃	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH₃	0	0
256	6-NHCOC ₆ H ₅	CH ₃	CH3	H	C 8 H 5	C ₆ H ₅	CH3	0	0
257	6-SCH ₃	CH3	CH₃	H	C_6H_5	C ₆ H ₅	CH ₃	0	0
258	6-SC ₂ H ₅	CH ₃	CH₃	Н	C ₆ H ₅	C 6 H 5	CH₃	0	0

No.	Ri	R²	R³	R ⁴	R ⁵	Re	R ⁷	X	Y
1259	6-SCH(CH ₃) ₂	CH3	CH3	Н	CeH5	C ₆ H ₅	CH ₃	0	0
1260	6-S0 ₂ CH ₃	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1261	6-S0 ₂ C ₂ H ₅	CH3	CH3	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH ₃	0	0
1262	6-S0 ₂ CH(CH ₃) ₂	CH3	CH3	Н	C ₆ H ₅	CeHs	CH ₃	0	0
1263	6-SC ₆ H ₅	CH3	CH3	Н	CeHs	CeHs	CH ₃	0	0 .
1264	6-SCH ₂ C ₆ H ₅	CH3	CH3	H	CeHs	CeHs	СН₃	0	0
1265	6-NHSO ₂ CH ₃	CH3	CH3	H	CeHs	CeH5	CH ₃	0	0
1266	6-NHSO ₂ C ₂ H ₅	CH3	СНз	H	CeHs	CeHs	CH ₃	0	0
1267	6-NHSO ₂ C ₆ H ₅	CH3	CH3	Н	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	[*] 0	0
1268	6-COOH	CH3	CH3.	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	0	0
1269	6-C00CH ₃	CH3	CH3	Н	CeHs	CeHs	CH ₃	0	0
1270	6-C00C ₂ H ₅	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH3	0.	0
1271	6-COOCH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	CH3	H	CeH5	CeH5	СНз	0	0
1272	6-N(CH ₃) ₂	CH3	CH3	H	CeHs	CeHs	CH ₃	0	0
1273	6-NHCH ₃	CH ₃	CH3	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH₃	0	0
1274	6-NH(C ₂ H ₅) ₂	CH3	CH ₃	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	0	0
1275	6-CONH ₂	CH3	CH3	H	CeHs	CeHs	CH ₃	0	0
1276	6-CONHCH3	CHa	CH3	H	CeHs	CeH5	CH₃	0	0
1277	6-CON(CH ₃) ₂	CH ₃	CH3	Н	CeHs	C ₆ H ₅	CH ₃	0	0
1278	6-OCONHCH3	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	C _e H ₅	CH ₃	0	0
1279	6-0CON(CH ₃) ₂	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH ₃	0	0
1280	6-OCONHCH ₂ C ₆ H ₅	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH3	0	0
1281	6-OCSNHCH3	CH3	CH3	H	CeHs	CeHs	CH3	0	0
1282	6-0CSN(CH ₃) ₂	CH3	CH ₃	H	C ₈ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	0	0
1283	6-OCSNHCH2C6H5	CH3	CH₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	0	0
1284	6-SO2NHCH3	CH ₃	CH ₃	Н	CeH5	C ₆ H ₅	CH3_	0	0_

No.	R¹	R²	R³	R ⁴	R 5	R ⁶	R ⁷	Х	Y
1285	6-SO ₂ N(CH ₃) ₂	CH ₃	CH₃	Н	C & H 5	C & H 5	CH₃	0	0
1286	6-S02NHC2H5	CH3	CH ₃	H	CeHs	СеНь	CH3	0	0
1287	6-SO ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	CH3	CH3	H	CeHs	CeHs	CH3	0	0
1288	6-S02NHC6H5	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	0	0
1289	6-CF ₃	CH ₃	CH₃	H	CeHs	CeH5	CH3	0	0
1290	5-C1	Н	Н	H	C & H &	C ₆ H ₅	CH3	0	H ₂
1291	5-Br	H	H	H	CeHs	CeHs	CH3	0	H ₂
1292	5-F	H	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH3	0	H ₂
1293	5-CH ₃	Н	H	Н	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH3	0	H_2
1294	5-C ₂ H ₅	H	H	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH3	0	H ₂
1295	5-CH2CH2CH3	H	H	H	C 6 H 5	C 8 H 5	CH3	0	H_2
1296	5-CH(CH ₃) ₂	H	H	H	CeHs	СеНь	CH₃	0	H_2
1297	5-CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C&H5	CH₃	0	H_2
1298	5-0CH ₃	H	H	H	C 6 H 5	C 6 H 5	CH3	0	H_2
1299	5-0C ₂ H ₅	H	H	H	CeHs	CeHs	CH₃	0	H_2
1300	5-0CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C 6 H 5	CeHs	CH3	0	H ₂
1301	5-0C ₆ H ₅	H	H	H	C 6 H 5	CeHs	CH₃	0	H_2
1302	5-COCH ₃	H	H	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH3	0	H_2
1303	5-0C0CH ₃	H	H	H	C 8 H 5	CeHs	CH3	0	H_2
1304	5-0H	H	H	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH3	0	H_2
1305	5-NH ₂	H	H	H	C 6 H 5	C 8 H 5	CH₃	0	H ₂
1306	5-N0 ₂	H	H	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH₃	0	H_2
1307	5-CN	H	H	Н	C_6H_5	C ₆ H ₅	CH₃	0	H_2
1308	5-NHCOCH ₃	H	Н	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	0	H_2
1309	5-NHCOC 6 H 5	Н	Н	Н	CeHs	C 6 H 5	CH₃	0	H ₂

				54	D.F.	D.R.	D.7	v	Y
No.	R¹	R²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ^e	R ⁷	<u> </u>	
1310	5-SCH ₃	H	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH₃	0	H ₂
1311	5-SC₂H₅	H	H	Н	CeH5	C ₆ H ₅	CH3	0	H_2
1312	5-SCH(CH ₈) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	0	H_2
1213	5-S0 ₂ CH ₃	H	H	H	CeHs	C 6 H 5	CH3	0	H_2
1314	5-S0 ₂ C ₂ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	H_2
1315	5-S0 ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	H_2
1316	5-SC ₆ H ₅	H	H	H	CeHs	CeHs	CH3	0	H_2
1317	5-SCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	CeHs	CeHs	CH ₃	0	H_2
1318	5-NHSO2CH3	H	H .	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	. 0	H ₂
1319	5-NHSO ₂ C ₂ H ₅	H	H ·	H	C_6H_5	CeHs	CH ₃	0	H_2
1320	5-NHSO ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	H_2
1321	5-C00H	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	0	H ₂
1322	5-C00CH3	H	H	H	CeHs	CeHs	CH3	0	H_2
1323	5-C00C ₂ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH₃	0	H_2
1324	5-C00CH2C6H5	H	H	H	CeH5	СеНь	CH₃	0	H_2
1325	5-N(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	0	H_2
1326	5-NHCH₃	H	H	H	CeHs	CeH5	CH3	0	H ₂
1327	5-NH(C ₂ H ₅) ₂	H	H	H	CeHs	CeHs	CH3	0	H_2
1328	5-CONH ₂	H	H	H	СеНь	C ₆ H ₅	CH3	0	H_2
1329	5-CONHCH ₃	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	0	H_2
1330	5-CON(CH ₈) ₂	H	H	H	CeHs	CeH5	CH3	0	H ₂
1331	5-OCONHCH ₃	H	H	H	CeHs	CeHs	CH3	0	H_2
1332	5-0CON(CH ₃) ₂	H	H	H	C_6H_5	CeHs	CH₃	0	H_2
1333	5-OCONHCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	0	H ₂
1334	5-OCSNHCH ₃	H	H	H	CaHs	C ₆ H ₅	CH3	0	H ₂
1335	5-0CSN(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	H ₂

No.	R¹	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	X	Y
1336	5-OCSNHCH2CeH5	Н	H	Н	C 6 H 5	C ₆ H ₅	СН₃	0	H_2
1337	5-SO2NHCH3	H	H	Н	C 8 H 5	CeH5	CH₃	0	H_2
1338	5-S0 ₂ N(CH ₈) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH₃	0	H_2
1339	5-S02NHC2H5	H	H	H	C ₈ H ₅	CeHs	CH₃	0	H_2
1340	5-S0 ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	H	H	Н	C ₆ H ₅	СвНв	CH₃	0	H_2
1341	5-S02NHC6H5	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	0	H_2
1342	5-CF ₃	H	Н	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH₃	0	H ₂
1343	7-C1	Н	H	H .	C e H 5	C ₆ H ₅	CH3	0	H ₂
1344	7-Br	H	H	H	C ₆ H ₅	C _e H ₅	CH3	0	H_2
1345	7-F	H	H	H	C 6 H 5	C 6 H 5	CH₃	0 ·	H_2
1346	7-CH ₃	H	H	H	CeHs	C 8 H 5	CH3	0	H_2
1347	7-C ₂ H ₅	H	H	H	CeH5	СвНь	CH₃	0	H_2
1348	7-CH(CH ₃) ₂	H	H	Н	CeHs	CeHs	CH3	0	H_2
1349	7-CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	0	H_2
1350	7-0CH ₃	H	H	H	CeHs	CeHs	CH₃	0	H_2
1351	7-0C ₂ H ₅	H	H	Н	C 6 H 5	C 8 H 5	CH3	0	H_2
1352	7-0CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C 6 H 5	C 6 H 5	CH3	0	H_2
1353	7-0C ₆ H ₅	H	H	H	CeHs	СеНь	CH₃	0	H ₂
1354	7-COCH ₃	H	H	Н	C ₆ H ₅	C 6 H 5	CH₃	0	H ₂
1355	7-0C0CH ₃	H	H	Н	CeHs	C & H 5	CH3	0	H ₂
1356	7-0H	H	H	Н	CeH5	CaHs	CH₃	0	H ₂
1357	7-NH ₂	H	H	H	CeHs	CeHs	CH ₃	0	H ₂
1358	7-N0 ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	H_2
1359	7-CN	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH 3	0	H ₂
1360	7-NHCOCH ₃	H	H	H	C 6 H 5	C & H 5	CH₃	0	H ₂

No.	R1	R²	R³	R ⁴	R ^s	R ⁶	R ⁷	X	Y
1361	7-NHCOC ₆ H ₅	Н	H	Н	CeH5	CeH5	CH₃	0	H ₂
1362	7-SCH ₃	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	. 0	H_2
1363	7-SC ₂ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	H_2
1364	7-CH2CH2CH3	H	H	H	CeHs	CeH5	CH3	0	H_2
1365	7-SCH(CH ₃) ₂	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	0	H_2
1366	7-S0 ₂ CH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH3	0	H_2
1367	7-S0 ₂ C ₂ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	0	H_2
1368	7-S0 ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	H	CeH5	CeH5	CH₃	0	H_2
1369	7-SC & H 5	H	H	Ħ	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	0	H_2
1370	7-SCH2C6H5	H	H .	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH₃	0	H_2
1371	7-NHSO ₂ CH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH₃	0	H_2
1372	7-NHS0 ₂ C ₂ H ₅	H	H	H ·	C ₆ H ₅	CeHs	CH₃	0	H ₂
1373	7-NHSO ₂ C ₆ H ₅	H,	H	H	$C_{\mathfrak a}H_{\mathfrak b}$	CeHs	CH3	0.	H_2
1374	7-C00H	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₅ H ₅	CH3	0	H_2
1375	7-C00CH ₃	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	0	H_2
1376	7-C00C ₂ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	0	H_2
1377	7-C00CH2C6H5	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	0	H_2
1378	7-N(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	0	H_2
1379	7-NHCH ₃	H	H	H	CeH5	CeHs	CH₃	0	H_2
1380	7-NH(C ₂ H ₅) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH₃	0	H_2
1381	7-CONH ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	0	H_2
1382	7-CONHCH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	0	H_2
1383	7-CON(CH ₃) ₂	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	0	H_2
1384	7-OCONHCH₃	H	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH3	0	H_2
1385	7-0CON(CH ₃) ₂	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	СН₃	0	H_2
1386	7-0CONHCH2C6H5	H	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH3	0	H ₂

No.	R¹	R ²	R³	R ⁴	R 5	R ⁶	R ⁷	Х	Y
1387	7-OCSNHCH₃	H	Н	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	0	H ₂
1388	7-0CSN(CH ₃) ₂	H	H	H	C & H 5	CeHs	CH₃	0	H ₂
1389	7-OCSNHCH2C6H5	Н	H	Н	C ₆ H ₅	CeHs	CH₃	0	H_2
1390	7-SO2NHCH3	H	H	H	C & H 5	C ₆ H ₅	CH ₃	0	H ₂
1391	7-S0 ₂ N(CH ₃) ₂	Н	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	0	H_2
1392	7-S02NHC2H5	H	H	Н	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	0	H_2
1393	7-S0 ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	0	H 2
1394	7-S02NHC6H5	.H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	0	H_2
1395	7-CF ₃	H	H	H	C & H 5	C ₆ H ₅	CH₃	0	H_2
1396	6-C1	Н	Н	Н	C & H 5	CeHs	CH₃	0	H_2
1397	6-Br	H	H	Н	C & H 5	C & H 5	CH3	0	H ₂
1398	6-F	H	Н -	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH3	0	H ₂
1399	6-CH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	0	H ₂
1400	6-C ₂ H ₅	H	H	H	C6H5	CeHs	CH3	0	H_2
1401	6-S0 ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	H	C 6 H 5	C 6 H 5	CH3	0	H_2
1402	6-CH(CH ₃) ₂	H	H	Н	C 6 H 5	CeHs	CH3	0	H ₂
1403	6-CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C_8H_5	СеНь	CH3	0	H_2
1404	6-0CH ₃	H	H	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	СН₃	0	H_2
1405	6-0C ₂ H ₅	H	H	Н	CeH5	C 6 H 5	CH3	0	H ₂
1406	6-0CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	CeH5	CeHs	CH₃	0	H ₂
1407	6-0C ₆ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	0	H_2
1408	6-COCH ₃	H	Н	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH3	0	H_2
1409	6-0COCH ₃	H	H	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH3	0	H ₂
1410	6-0H	H	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH ₃	0	H ₂
1411	6-NH ₂	H	Н	Н	CeHs	CeHs	CH ₃	0	H 2

No.	R¹	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	X	Y
 1412	6-NO ₂	H	H	Н	C _e H ₅	CeH5	CH₃	0	H ₂
1413	6-CN	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	0	H ₂
1414	6-NHCOCH ₃	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH ₃	0	H_2
1415	6-NHCOC & H 5	H	H	Н	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	0	H ₂
1416	6-SCH₃	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	0	H ₂
1417	6-SC ₂ H ₅	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	0	H_2
1418	6-SCH(CH ₃) ₂	Н	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	СН₃	0	H_2
1419	6-SO ₂ CH ₃	H	Н	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	0	H_2
1420	6-S0 ₂ C ₂ H ₅	H	Н	. Н	CeH5	CeHs	CH₃	. 0	H ₂
1421	6-SO ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	H	C _e H ₅	CeH5	CH3	0	H_2
1422	6-SC ₆ H ₅	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH₃	0	H_2
1423	6-SCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	0	H ₂
1424	6-NHSO ₂ CH ₃	H	H	H	CeHs	CeHs	CH3	0	H_2
1425	6-NHSO ₂ C ₂ H ₅	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	. 0	H ₂
1426	6-NHSO ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	CeH5	C ₆ H ₅	СНз	0	H_2
1427	6-C00H	H	H	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	0	H_2
1428	6-C00CH3	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH3	0	H_2
1429	6-C00C ₂ H ₅	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH3	0	H_2
1430	6-C00CH2C6H5	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH3	0	H_2
1431	6-N(CH ₃) ₂	H	H	H	CeHs	CeH5	CH₃	0	H_2
1432	6-NHCH₃	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	СНз	0	H_2
1433	6-NH(C ₂ H ₅) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	0	H_2
1434	6-CONH ₂	H	H	H	C ₈ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	0	H_2
1435	6-CONHCH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH₃	0	H_2
1436	6-CON(CH ₃) ₂	H	H	H	CeHs	CeHs	CH₃	0	H ₂
1437	6-OCONHCH3	H	H	Н	СеНъ	C ₆ H ₅	CH₃	0	H ₂

No.	R¹	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R e	R ⁷	Х	Y
1438	6-0CON(CH ₃) ₂	Н	Н	Н	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH₃	0	H ₂
1439	6-OCONHCH ₂ C ₈ H	5 H	H	H	C 6 H 5	CeH5	CH₃	0	H ₂
1440	6-OCSNHCH ₃	H	H	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	0	H ₂
1441	6-OCSN(CH ₃) ₂	H	H	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	0	H_2
1442	6-OCSNHCH ₂ C ₆ H	5 H	Н	H	C ₆ H ₅	CoHs	CH3	0	H ₂
1443	6-SO ₂ NHCH ₃	Н	Н	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	0	H_2
1444	6-SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	H	H	CeH5	CeHs	CH3	0	H_2
1445	6-S02NHC2H5	Н	H	H	C & H 5	C ₆ H ₅	CH ₃	0	H ₂
1446	6-S0 ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	Н	Н	.Н .	CeHs	СеНь	CH ₃	0	H ₂
1447	6-S02NHC8H5	Н	Н	H	C 8 H 5	C 8 H 5	CH₃	0	H_2
1448	6-CF ₃	H	H	H	CeHs	CeHs	CH3	0	H_2
		-							
1449	6-C1	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	C_6H_5	CH3	0	H_2
1450	6-Br	СНз	СНз	H	CeH5	CeHs	CH₃	0	H ₂
1451	6-F	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	0	H ₂
1452	6-CH ₃	CH3	CH3	H	C 6 H 5	CeHs	CH3	0	H ₂
1453	6-C ₂ H ₅	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH₃	0	H_2
1454	6-SO ₂ CH(CH ₃) ₂	CH3	CH3	Н	C 6 H 5	C & H 5	CH3	0	H 2
1455	6-CH(CH ₃) ₂	CH3	CH₃	H	C & H 5	CeHs	CH ₃	0	H_2
1456	6-CH ₂ C ₆ H ₅	CH3	CH3	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH ₃	0	H_2
1457	6-0CH ₃	CH3	CH3	H	C & H 5	C 6 H 5	CH ₃	0	H_2
1458	6-0C ₂ H ₅	CH3	CH3	H	C 8 H 5	CoHs	CH₃	0	H_2
1459	6-0CH ₂ C ₆ H ₅	СНз	CH3	H	C 6 H 5	C ₆ H ₅	CH ₃	0	H_2
1460	6-0C ₆ H ₅	СНз	CH3	H	C & H 5	C ₆ H ₅	CH ₃	0	H_2
1461	6-COCH ₃	СНз	CH3	H	C e H 5	C ₆ H ₅	CH ₃	0	H ₂
1462	6-OCOCH ₃	CH₃	CH3	Н	C ₈ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	0	H ₂

No.	R¹	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	Х	Y
1463	6-0H	CH ₃	CH₃	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH₃	0	H ₂
1464	6-NH ₂	CH ₃	CH3	H	CeHs	C ₆ H ₅	CH3	0	H_2
1465	6-NO ₂	СНз	CH₃	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	0	H_2
1466	6-CN	CH₃	CH₃	Н	C ₆ H ₅	СвНБ	CH3	0	H_2
1467	6-NHCOCH ₃	СНз	CH₃	H	C ₆ H ₅	CsHs	CH3	0	H_2
1468	6-NHCOC eH s	СНз	CH₃	H	CeHs	CeHs	CH3	0	H_2
1469	6-SCH₃	СН₃	CH₃	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	0	H_2
1470	6-SC ₂ H ₅	CH3	CH₃	H	CeHs	CeHs	CH3	0	H_2
1471	6-SCH(CH ₃) ₂	CH₃	CH₃	H	CeHs	CeHs	СНз	0	H_2
1472	6-SO ₂ CH ₃	CH₃	CH3 -	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH ₃	0	H_2
1473	6-S0 ₂ C ₂ H ₅	CH₃	CH₃	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH ₃	0	H_2
1474	6-S0 ₂ CH(CH ₃) ₂		CH3	Н	CeHs	CeHs	CH3	0	H_2
1475	6-SC ₆ H ₅	CH ₃	CH₃	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH₃	0	H_2
1476	6-SCH ₂ C ₆ H ₅	CH3	CH₃	H	CeH5	C ₆ H ₅	CH ₃	0	H_2
1477	6-NHSO2CH3	CH3	CH3	H	CeHs	CeHs	CH3	0	H_2
1478	6-NHSO ₂ C ₂ H ₅	CH3	CH3	H	CeH5	СвНь	CH3	<u>0</u>	H_2
1479	6-NHSO ₂ C ₆ H ₅	СН₃	CH₃	H	C _e H ₅	CeHs	CH₃	0	H_2
1480	6-C00H	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH₃	0	H_2
1481	6-C00CH₃	CH₃	CH3	H	C ₆ H ₅	CoHo	CH ₃	0	H_2
1482	6-C00C ₂ H ₅	CH₃	CH3	H	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	0	H_2
1483	6-C00CH ₂ C ₆ H ₅	CH3	CH3	H	CeHs	CeHs	CH ₃	0	H2
1484	6-N(CH ₃) ₂	CH₃	CH₃	H	CeH5	CeHs	CH₃	0	H_2
1485	6-NHCH ₃	CH₃	CH3	H	C ₆ H ₅	C ₅ H ₅	CH3	0	H_2
1486	6-NH(C ₂ H ₅) ₂	CH3	CH₃	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH3	0	H_2
1487	6-CONH ₂	CH₃	CH₃	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH ₃	0	H_2
1488	6-CONHCH ₃	CH₃	CH ₃	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	0	H ₂

No.	R¹	R²	R³	R4	R ⁵	R ⁶	R ⁷	Х	Y
1489	6-CON(CH ₃) ₂	CH ₃	CH₃	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH₃	0	H ₂
1490	6-OCONHCH₃	CH3	CH3	H	C & H 5	C ₆ H ₅	CH ₃	0	H ₂
1491	6-0CON(CH ₃) ₂	CH3	CH3	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	H ₂
1492	6-OCONHCH ₂ C ₆ H ₅	CH₃	CH ₃	H	CeH5	C _e H ₅	CH ₃	0	H ₂
1493	6-OCSNHCH3	CH3	CH3	Н	C ₆ H ₅	СеНь	CH ₃	0	H ₂
1494	6-OCSN(CH ₃) ₂	CH₃	CH3	H	C ₆ H ₅	CeH5	CH 3	0	H ₂
1495	6-OCSNHCH ₂ C ₈ H ₅	CH ₃	CH₃	Н	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	CH3	0	H ₂
1496	6-SO2NHCH3	CH3	CH3	H	C ₆ H ₅	CeHs	CH ₃	0	H ₂
1497	6-SO ₂ N(CH ₃) ₂	CH ₃	CH3	H	CaHs	C ₆ H ₅	CH₃	0	H ₂
1498	6-S02NHC2H5	CH3	CH3	Н	CeHs	CeHs	CH₃	0	H ₂
1499	6-S0 ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	CH 3	CH₃	H	СеНь	C ₆ H ₅	CH₃	0	H2
1500	6-SO ₂ NHC ₆ H ₅	CH ₃	CH3	H	CeHs	C ₆ H ₅	СН₃	0	H2
1501	6-CF ₃	CH ₃	CH ₃	Н	C & H 5	CeH5	СН₃	.0	H ₂ _

$$\begin{array}{c|c}
R^1 & & & & & & & & & & \\
\hline
R^1 & & & & & & & & & \\
\hline
R^2 & & & & & & & & \\
R^4 & & & & & & & & \\
\hline
R^6 & & & & & & & \\
\hline
R^5 & & & & & & & \\
\end{array} (1)$$

No.	R¹	R ²	R³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A	X	Y
 1502	H	H	H	Н	CeH5	C ₆ H ₅	CH ₂	H ₂	0
1503	Н	CH ₃	CH3	H	CeHs	CeHs	. 0	H_2	0
1504	Н	Н	H	H	C ₈ H ₅	CeH5	S	H_2	0
1505	Н	Н	H	H	C ₈ H ₅	CeHs	N-CH ₃	0	0
1506	H	СН₃	СНз	H	CeH5	ÇI CI	-	H ₂	0
1507	H	CH3	CH₃	H	CeHs		_	H ₂	0
1508	Н	CH₃	СНз	H	C ₆ H ₅	- ⊘ 00	CH ₃ _	H ₂	0
1509	Н	CH3	CH ₃	H	C ₆ H ₅	-⟨H⟩	<u> </u>	H_2	0
1510	Н	CH ₃	СН₃	H	C ₆ H ₅	$\overline{\lozenge}$	-	H ₂	0
1511	Н	Н	H	H	CeH5	√⊘	CH ₂	H ₂	H ₂
1512	Н	СН₃	CH3	H	C ₆ H ₅	√	0	H ₂	H ₂
1513	Н	Н	Н	Н	C _e H ₅	$\overline{\lozenge}$	S	H_2	H ₂
1514	Н	Н	Н	H	CeH5	$\overline{\langle 0 \rangle}$	N-CH ₃	0	H ₂

R¹	R²	R³	R ⁴	R ⁵	R e	A	X	Y
Н	CH3	CH₃	Н	C ₈ H ₅	ÇI CI	_	H ₂	H ₂
Н	CH ₃	CH ₃	H	C ₆ H ₅			H2	H2
H	CH ₃	CH ₃	H	C 6 H 5	-OCI	i ₃ –	H ₂	H ₂
H	CH ₃	СН₃	H	C ₆ H ₅	\overline{H}	-	H ₂	H_2
H	CH3	CH ₃	H	C ₆ H ₅	-⟨ \	_	H ₂	H2
	Н Н Н	H CH ₃ H CH ₃ H CH ₃	H CH ₃ CH ₃ H CH ₃ CH ₃ H CH ₃ CH ₃	H CH ₃ CH ₃ H	H CH ₃ CH ₃ H C ₆ H ₅ H CH ₃ CH ₃ H C ₆ H ₅ H CH ₃ CH ₃ H C ₆ H ₅ H CH ₃ CH ₃ H C ₆ H ₅	H CH3 CH3 H C6H5 C1 C1 H CH3 CH3 H C6H5 C1 H CH3 CH3 H C6H5 C1 CH3 CH3 H C6H5 C1	H CH ₃ CH ₃ H C ₆ H ₅ C1 C1 — H CH ₃ CH ₃ H C ₆ H ₅ OCH ₃ — H CH ₃ CH ₃ H C ₆ H ₅ — H CH ₃ CH ₃ H C ₆ H ₅ — N	H CH_3 CH_3 H C_6H_5 $C1$ $C1$ — H_2 H CH_3 CH_3 H C_6H_5 $C1$ — H_2 H CH_3 CH_3 H C_6H_5 — OCH_3 —

また、本発明は、一般式 (I')

$$R^{1} \xrightarrow{A} X$$

$$R^{2}$$

$$R^{4} \xrightarrow{NH} R^{6}$$

$$R^{5}$$

$$R^{6}$$

〔式中、Aはメチレン基、酸素原子、硫黄原子、-N(R7)-で表される基(式中、R7 は水素、炭素数 $1\sim 6$ 個のアルキルまたはアラルキルを示す。)または直接結合を示す。Xは酸素原子、硫黄原子または水素 2 原子を示す。R1 は水素、ハロゲン、炭素数 $1\sim 6$ 個のアルキル、ハロアルキル、アラルキル、炭素数 $1\sim 6$ 個のアルコキシ、アラルキルオキシ、アリールオキシ、アシル、アシルオキシ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、シアノまたは式

- $-NHCOR^*$, $-S(O)_{2}R^*$, $-NHSO_{2}R^*$, $-COOR^*$,
- $-N(R^{s})(R^{s}), -CON(R^{s})(R^{s}), -O-CO-N(R^{s})(R^{s}),$
- $-O-CS-N(R^{8})(R^{9}), -SO_{2}N(R^{9})(R^{9})$

(式中、R⁸, R⁸ は同一または異なってそれぞれ水素、炭素数1~6個のアルキル、フェニルまたはアラルキルを示し、nは0,1または2を示す。)から選ばれる基を示す。R², R³ は同一または異なって水素または炭素数1~6個のアルキルを示す。R⁴ は水素または炭素数1~6個のアルキルを示す。R⁵ はチエニルまたはフェニルを示す。R⁶ は炭素数1~6個のアルキル、炭素数2~6個のアルケニル、炭素数3~7個のシクロアルキル、フリル、チエニル、ピリジル、インドリル、ビフェニルまたはフェニルを示す。〕

により表されるキヌクリジン化合物またはその医薬上許容されうる酸付加塩も提供する。

一般式 (I')で表される化合物(以下、化合物(I')という)は、一般式(I)においてYが水素 2原子で飽和された化合物の合成中間体としても有用である。

本発明化合物は、以下に示す方法によって製造することができる。 方法1

一般式(I)においてYが酸素原子である化合物は、米国特許第3,560,510号明細書またはジヤーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー(Journal of Medicinal Chemistry)第10巻、Na6、587頁に記載の方法に準じて合成される一般式(II)

$$R^4$$
 NH_2
 R^6
(11)

(式中、各記号は前記と同義である。)

により表される化合物(以下、化合物(II)という)と、米国特許第4,892,872号明細書またはヨーロッパ公開特許第407137号公報に記載の方法に準じて合成される一般式(III)

(式中、各記号は前記と同義である。)

により表されるカルボン酸またはその反応性誘導体とを縮合させることにより得られる。

化合物(II)と一般式(III)で表される化合物(以下、化合物(III)という)との縮合反応は、それ自体公知のアミド化法あるいはペプチド合成法などが準用できる。たとえば化合物(III)が遊離のカルボン酸の場合、そのアミド化反応は、ジシクロヘキシルカルボジイミド、ハロゲン化リン(三塩化リン、オキシ塩化リンなど)、ジフェニルホスホリルアジド、2-クロロ-N-メチルピリジニウムヨーダイド-トリブチルアミン系(向山法)などの縮合剤の存在下に、不活性溶

媒中あるいは無溶媒で、冷却下または室温ないし加温下に行われる。一般式 (III) で表されるカルボン酸の反応性誘導体が酸ハライド(酸クロリド、酸プロミドな ど) あるいは混合酸無水物(低級アルキル炭酸混合酸無水物、アルキルリン酸混 合酸無水物など)の場合、その反応は、不活性溶媒中あるいは無溶媒で、好まし くはトリエチルアミン、N-メチルモルホリン、ピリジン、ジメチルアニリンな どの有機塩基、あるいは炭酸水素アルカリ、炭酸アルカリ、水酸化アルカリなど の無機塩基の脱酸剤の存在下に冷却下から加温下に行われる。さらに、反応性誘 導体として低級アルキルエステル (メチルエステル、エチルエステルなど)、あ . るいはいわゆる活性エステル(p-ニトロフェニルエステル、p-クロロベンジ ルエステル、p-クロロフェニルエステル、コハク酸イミドエステル、ベンゾト リアゾールエステルなど)を用いる場合、反応は不活性溶媒中あるいは無溶媒で 室温から加温下によって行われる。以上に述べたアミド化反応に用いられる不活 性溶媒としてはヘキサン、ベンゼン、トルエンなどの炭化水素類、クロロホルム、 ジクロロメタン、ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素類、テトラヒドロフ ラン、ジオキサンなどのエーテル類、酢酸エチルなどのエステル類、アセトンな どのケトン類、メタノール、エタノール、イソプロピルアルコールなどのアルコ ール類、ジメチルホルムアミドなどのアミド類、アセトニトリル、ジメチルスル ホキシド、水など、またはその混合溶媒があげられ、反応に応じて適宜選択する ことができる。

方法2

一般式(I)においてYが水素で飽和された化合物は、化合物(II)と米国特許第4,892,872号明細書またはヨーロッパ公開特許第407137号公報に記載の方法に準じて合成される一般式(IV)

$$R^1$$
 CHO
 R^2
 R^2
 CIV

(式中、各記号は前記と同義である。)

により表される化合物(以下、化合物(IV)という)とを還元的縮合反応に付すか;米国特許第3,506,673号明細書に記載の方法に準じて合成される一般式(V)

$$R^4 \longrightarrow R^6$$
 (V)

(式中、各記号は前記と同義である。)

により表される化合物(以下、化合物(V)という)と一般式(VI)

$$R^{1}$$
 O
 R^{2}
 R^{2}
 $CH_{2}NH_{2}$
 (VI)

(式中、各記号は前記と同義である。)

により表される化合物(以下、化合物(VI)という)とを還元的縮合反応に付すか;化合物(VI)と一般式(VII)

$$R^4 \longrightarrow L$$

$$R^6$$
(VII)

〔式中、Lは反応活性な脱離基(有機合成化学上よく知られる脱離基を示し、たとえば塩素、臭素、沃素、フッ素などのハロゲン、メタンスルホニルオキシ、トリフルオロメタンスルホニルオキシ、p-トルエンスルホニルオキシ、ニトロベンゼンスルホニルオキシなどのスルホン酸エステル基など)を示し、他の各記号は前記と同義である。〕

により表される化合物(以下、化合物(VII)という)を縮合反応に付すか;または化合物(II)と一般式(VIII)

$$\begin{array}{c|c}
R^1 & X \\
\hline
& R^2 \\
CH_2-L
\end{array}$$
(VIII)

(式中、各記号は前記と同義である。)

により表される化合物(以下、化合物(VIII)という)とを縮合させることによって製造することができる。

化合物(II)と化合物(IV)との還元的縮合反応、および化合物(V)と化合 物 (VI) との還元的縮合反応は、本反応を阻害しない適当な溶媒中、還元剤の存 在下に行われるか、または、触媒量の脱水剤の存在下あらかじめ相当するイミン (シッフの塩基) に誘導した後、続いて還元剤を添加することにより行われる。 溶媒としては前述した溶媒を用いることができる。還元条件としては、白金、パ ラジウム、ラネーニッケル、ロジウムなどの金属やそれらの担体との混合物を触 媒とする接触的水素還元;または水素化リチウムアルミニウム、水素化シアノホ ウ素ナトリウム、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素カリウムなどの水素化 金属類による還元; 金属ナトリウム、金属マグネシウムなどとメタノール、エタ ノールなどのアルコールによる還元;鉄、亜鉛などの金属と塩酸、酢酸などの酸 による還元などの反応条件を挙げることができる。特に、水素化シアノホウ素ナ トリウムなどの水素化金属類による還元の場合、好ましくは塩酸または酢酸など の酸の存在下に実施するのが望ましい。必要に応じて用いられる脱水縮合剤とし ては特に限定はなく、無機酸(塩酸、硫酸、硝酸など)、有機酸(メタンスルホ ン酸、pートルエンスルホン酸など)、ルイス酸(塩化アルミニウム、四塩化錫、 塩化鉄、トリフルオロボランエテラート、ジブチル錫ジクロリドなど)、モレキ ュラーシーブなどが挙げられる。遠元的縮合反応の温度は用いられる溶媒により 異なるが、一般には-20℃~100℃が好ましい。また、本反応は常圧で十分 目的を達成できるが、場合によっては加圧あるいは減圧下に行ってもよい。

化合物 (VI) と化合物 (VII)との縮合反応、および化合物 (II) と化合物 (VIII)

WO 93/09116 PCT/JP92/01426

との縮合反応は、塩基の存在下または非存在下に、本反応を阻害しない溶媒(ヘキサン、ベンゼン、トルエンなどの炭化水素類、クロロホルム、ジクロロメタンなどのハロゲン化炭化水素類、酢酸エチルなどのエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミドなどのアミド類、アセトニトリル、ジメチルスルホキシドなど)中、または無溶媒で行われる。必要に応じて用いられる塩基としては特に限定はなく、好ましくは炭酸ナトリウム、炭酸カリウムなどのアルカリ炭酸金属塩、炭酸水素ナトリウムなどのアルカリ炭酸水素金属塩、水素化ナトリウム、水素化リチウムなどの水素化アルカリ金属、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム第三プトキシドなどのアルカリ金属アルコキシド、トリエチルアミン、ピリジンなどの有機塩基が挙げられる。また、テトラーローブチルアンモニウムプロマイド、ベンジルトリエチルアンモニウムヨーダイドなどの相間移動触媒を用い、水とその他の有機溶媒との混合溶媒中で反応を行う場合には、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどの水酸化アルカリ金属を用いることもできる。反応は通常0℃~150℃で行われる。

なお、化合物(VI)は一般式(III)で表されるカルボン酸誘導体をアミド体へ と導き、有機化学上公知の方法に準じて還元することによって容易に合成するこ とができる。

また、化合物(VIII)は、たとえば一般式(III)で表されるカルボン酸またはそのエステル体を有機化学上公知の方法により還元してアルコール体へと導き、さらにその水酸基をハロゲン化することなどにより、容易に合成される。 方法3

一般式(I)においてYが水素で飽和された化合物は、化合物(I')を還元反応に付すことによっても製造することができる。

還元反応は反応を阻害しない溶媒中、冷却下ないし加温下において行われる。 還元剤としては水素化リチウムアルミニウム、水素化アルミニウム、トリメトキシ水素化リチウムアルミニウム、メトキシエトキシアルミニウムハイドライド、ナトリウムビスー(2-メトキシエトキシ)アルミニウムハイドライド、ボランなどの無機水素化物などが挙げられる。

万法4

一般式 (I) においてYが硫黄原子である化合物は、化合物 (I')をチオン化 試薬を用いて直接チオン化することによって製造される。

以上のようにして得られる反応生成物は再結晶法、カラムクロマトグラフィーなどの有機合成化学上よく知られた方法により、容易に精製することができる。なお、所望の絶対配置を有する立体異性体は光学活性な原料を用いて合成するか、あるいはラセミ体の反応生成物を適当な光学分割試薬を用いることにより、製造することができる。

また、このようにして得られた本発明の化合物(I)のいくつかは、常法により無機酸または有機酸と処理することによって前記に示した酸付加塩とすることができる。

本発明の化合物(I)、その異性体および医薬上許容されうる塩は、P物質の 拮抗作用を有することから、無痛覚症、炎症、喘息、アレルギー、中枢神経系疾 患、循環器系疾患、消化器系疾患などの諸症状において治療学的応用を見出すこ とができ、痛み(片頭痛など)、炎症、呼吸器系疾患(咳、喀痰などを伴う慢性 気管支炎、喘息、鼻炎など)、中枢神経系疾患(不安症、精神病など)、循環器 系疾患(高血圧症、心不全など)、消化器系疾患(過敏性大腸炎、潰瘍性大腸炎、 クローン病など)の治療薬として有用である。具体的には、鎮痛抗炎症薬、鎮咳 去痰剤、抗喘息薬、抗不安薬、降圧剤、抗潰瘍剤などとして用いられる。

以下に薬理実験例を示す。

実験例1:P物質受容体結合試験

モレキュラーファーマコロジー (Molecular Pharmacology) 23巻、563~

569頁(1983年)に報告されたリー(Lee)CMらの方法に従って本発明化合物のP物質拮抗作用を検討した。すなわち、雄ウィスターラットから下顎腺を取り出し、体積10倍の氷冷50mMトリス塩酸緩衝液(pH7.4)においてホモジナイズした。このホモジネートを300mMの塩化カリウムと10mMのEDTA存在下、氷冷にてインキュベートし、50,000×Gで遠心分離にかけた。こうして得られたペレットを体積20倍の氷冷50mMトリス塩酸緩衝液(pH7.4)に懸濁し、再度遠心分離し、得られたペレットを体積60倍のトリス塩酸緩衝液に懸濁して組織標本を作成した。

受容体結合試験は、上述の組織標本 $400\mu1$ に 50mMトリス塩酸緩衝液(pH7.4)、0.02%ウシ血清アルブミン、 $1\mug$ のキモスタチン、 $2\mug$ のロイペプチン、 $20\mug$ のバシトラシンならびに被験化合物を含む 1.2nMの放射性リガンド($[^3H]$ ーサブスタンスP)を添加し最終体積を $500\mu1$ とした。次に 20 ℃で 10 分間反応させた後、反応液に 5m1 のトリス塩酸緩衝液を加えすばやく吸引濾過し、フィルターを氷冷したトリス塩酸緩衝液 2m1 で 2m1 回洗浄した。フィルター上の放射能活性は液体シンチレーションカウンターで測定し、一般的な統計的手法により 50% 阻害濃度 $1C_{50}$ 値を求めた。特異的結合は、 1μ Mの P物質の存在下で試験して得られる非特異的結合を全体の結合から引くことにより求めた。その結果を次の表に示す。

化合物	I C 50 (n M)
実施例 6 の化合物	5. 4
実施例7の化合物	1 3
実施例17の化合物	1. 1
対照化合物	2 3

対照化合物はWO90/05729号にて公開された(\pm)ーシスー3ー{(2-メトキシフェニル)メチルアミノ}ー2ーベンズヒドリルキヌクリジンである。

実験例2:P物質誘発気道収縮に対する化合物の拮抗作用

ハートレイ (Hartley)系雌性モルモットをペントバルビタール (30 mg/kg) の腹腔内投与により麻酔し、気管と頸動脈のカニュレーションを行った。人工呼吸下 (50 strokes/分) で P物質 10 - *mol/kgの静脈投与による気道抵抗をコンツェット (Konzett)とロスラー(Rossler) の方法 [アルシーフ・フュア・エクスペリメンテレ・パトロギー・ウント・ファルマコロギー (Arch. Exp. Pathol. Pharmakol.) 195巻、71-74頁 (1940年)]を修正して測定した。10分間隔で P物質を投与した。収縮が安定したところで、次の P物質投与3分前に被験化合物を静脈投与し、その抑制率から50%有効量 (ED 50、mg/kg)を計算した。その結果を次の表に示す。

化合物	ED ₅₀ (mg/kg)
実施例7の化合物	0.083
実施例17の化合物	0.031
対照化合物	0. 11

(対照化合物は実験例1のものと同一である。)

実験例3:急性毒性

雄性ddYマウスを一群10匹として用い、実施例17の化合物3mg/kgを静脈内投与したところ、投与後5日間まで死亡例は認められなかった。

本発明の化合物(I)を前述の医薬として用いる場合、それ自体あるいは適宜、 薬理学的に許容される担体、賦形剤、希釈剤などと混合し、散剤、顆粒剤、錠剤、 カプセル剤、注射剤などの形態で経口的または非経口的に投与することができる。 投与量は対象疾患、症状、あるいは用いる化合物により異なるが、経口投与の場 合、通常、成人1日当たり1~100mg程度である。 以下に、実施例を挙げて本発明を具体的に説明するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

実施例1

公知の方法にて得られる6-クロロー3,4-ジヒドロー4-メチルー2H-1,4-ベンズオキサジン-8-カルボン酸4.83gとトリエチルアミン7.0m1のテトラヒドロフラン溶液70m1を-5℃に冷却する。この溶液に温度を-5℃に保ちながら塩化ピバロイル3.1m1を滴下する。同温で15分間撹拌後、公知の方法により製造されたシス-3-アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン5.84gの塩化メチレン溶液を滴下する。反応混合物を1時間撹拌後、減圧濃縮し塩化メチレンと1規定水酸化ナトリウム溶液に分配させる。有機層を食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥する。濃縮し、イソプロピルアルコールより結晶化し、この結晶をメタノールにより再結晶することにより、シスーN-(3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル))-6-クロロー3,4-ジヒドロ-4-メチル-2H-1,4-ベンズオキサジン-8-カルボキサミド2.2gを得る。融点240~241℃

NMR (CDC1 $_3$, 100MHz):

- 1.20-2.10 (5H), 2.70-2.90 (4H), 2.94 (3H, s), 3.44 (2H, m),
- 4.04 (2H. m), 4.51 (2H. m), 6.62 (1H. d. J=3Hz), 6.90-7.24 (11H).
- 8.01 (1H. d. J=10Hz)

元素分析: CsoHs4C1NsOとして

計算值: C 71.77, H 6.42, N 8.37

実測値: C 71.57, H 6.49, N 8.33

実施例2

2gを得る。融点254~255℃

NMR (CDC13, 100MHz):

- 1.60 (3H, s), 1.84 (3H, s), 2.60-3.05 (4H), 3.13 (2H, s),
- 3.94 (1H, dd, J=8Hz, 10Hz), 4.18 (1H, d, J=10Hz), 4.44 (1H, m),
- 6.70-7.25 (12H), 7.54 (1H, m), 8.12 (1H, d, J=8Hz)

元素分析: Cai Haa NaOa として

計算值: C 79.79, H 7.34, N 6.00

実測値: C 79.67, H 7.49, N 6.03

実施例3

2, 2-3メチルー5-メチルチオー2, 3-3ビドロベンゾフランー7-カルボン酸 2. 9 g と塩化ピバロイル 1. 4 6 m 1、トリエチルアミン 3. 3 6 m 1、シスー3-アミノー2-ベンズヒドリルキヌクリジン 2. 9 2 g を用いて実施例 1 と同じ製造法に付することにより、シスーNー〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕 - 2, 2-ジメチルー5-メチルチオー2, 3-ジヒドロベンゾフランー7-カルボキサミド 1. 2 g を得る。融点 2 1 $8 \sim 2$ 2 0 $^{\circ}$ NMR(CDC 1 3 . 1 0 0 MH 2):

111 (02013) 1 0 0141112/ .

- 1.60 (3H, s), 1.85 (3H, s), 1.10-2.10 (11H), 2.44 (3H, s),
- 2.64-3.04 (4H), 3.12 (2H), 3.80-4.26 (2H), 4.44 (1H, m),
- 6. 90-7. 24 (12H), 7. 48-7. 56 (1H), 8. 08 (1H, d, J=8Hz)

元素分析: C32H36N2O2Sとして

計算値: C 74.96, H 7.08, N 5.46

実測値: C 74.90, H 7.08, N 5.43

実施例4

2, 2-iジメチルー5-iニトロー2, 3-iジヒドロベンゾフランー7-iカルボン酸2. 9 g と塩化ピバロイル1. 4 6 m1、トリエチルアミン3. 3 6 m1、シスー3-iアミノー2-iベンズヒドリルキヌクリジン2. 9 2 g を用いて実施例1 と同じ製造法に付することにより、シスーN-i3 -i4 -i5 -i7 -i7 -i7 -i7 -i7 -i7 -i7 -i8 -i9 -i9 -i9 -i9 -i9 -i9 -i9 -i9 -i10 -i10 -i10 -i11 -i11 -i12 -i12 -i13 -i14 -i17 -i17 -i18 -i19 -i19

ラン-7-カルボキサミド1. 2gを得る。融点258~260℃ NMR (CDC13,100MHz):

1.60 (3H, s), 1.85 (3H, s), 1.10-2.10 (11H), 2.68-3.16 (4H),

3.24 (2H, s), 4.03 (1H, dd, J=7Hz.12Hz), 4.14 (1H, d, J=12Hz),

4.50 (1H, m), 6.84-7.28 (10H), 8.08 (1H, m), 8.49 (1H, J=2Hz)

元素分析: Cs1HssNsO4 として

計算值: C 72.78, H 6.50, N 8.21

実測値: C 72.65, H 6.47, N 8.17

実施例5

シスーNー〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕-2, 2-ジメチルー5-ニトロー2, 3-ジヒドロベンゾフランー7-カルボキサミド1.8g を窒素気流下、1モル濃度のボランのテトラヒドロフラン溶液20m1に溶解し、5時間還流する。反応液を濃縮後、5%塩酸30m1にて2時間還流を行い、冷却して水酸化ナトリウムよりアルカリ性とする。析出する物質をジクロロメタンで抽出後、有機層を硫酸マグネシウムで乾燥濃縮する。得られる残渣をエタノールから結晶化することにより、シス-3-〔(2, 2-ジメチル-5-ニトロー2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル〕アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン0.52gを得る。融点194~195℃

NMR $(CDC1_3, 100MHz)$:

1.44 (3H, s), 1.48 (3H, s), 1.04-2.12 (11H), 2.45-2.90 (4H),

3.00 (2H, s), 3.05-3.40 (3H), 3.67 (1H, dd, J=8Hz, 12Hz),

4.42 (1H, d, J=12Hz), 6.90-7.36 (11H), 7.82 (1H, m)

元素分析: C31 H35 N3O4 として

計算值: C 74.82, H 7.09, N 8.45

実測値: C 74.88. H 7.17. N 8.46

実施例6

9gと1モル濃度のボランのテトラヒドロフラン溶液 <math>20m1 を実施例 5 と同様の製造法に付すことにより、シスー3-((2,2-3)メチルー5-メチルチオー2、3-3ビドロベンゾフランー7-イル)メチル)アミノー2-ベンズヒドリルキヌクリジン0.85gを得る。融点136~138 $^{\circ}$

NMR (CDC1 $_3$, 100MHz):

- 1.37 (3H. s), 1.43 (3H. s), 1.10-2.10 (11H), 2.38 (3H. s),
- 2.45-2.90 (4H), 2.84 (2H, s), 3.00-3.40 (3H).
- 3. 66 (1H. dd. J=8Hz, 12Hz), 4. 46 (1H. d. J=12Hz).
- 6. 24 (1H. d. J=2Hz), 6. 92 (1H, d. J=1Hz), 7. 00-7. 38 (11H)

元素分析: C₃₂H₃₈N₂O₂Sとして

計算值: C 77.07, H 7.68, N 5.62

実測値: C 76.82, H 7.64, N 5.61

実施例7

シスーNー [3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-2, 2-ジメチル-2, 3-ジヒドロベンゾフランー7-カルボキサミド2.5 gと1モル濃度のボランのテトラヒドロフラン溶液27m1を実施例5と同様の製造法に付すことにより、シスー3-<math>[(2, 2-ジメチル-2, 3-ジヒドロベンゾフランー7-イル)メチル]アミノー2-ベンズヒドリルキヌクリジン1.50gを得る。融点164~165℃

NMR (CDC1₃, 100MHz):

- 1.37 (3H, s), 1.44 (3H, s), 1.10-2.20 (11H), 2.44-2.90 (4H),
- 2.93 (2H, s), 3.00-3.42 (3H), 3.66 (1H, dd, J=8Hz, 12Hz),
- 4.46 (1H. d. J=12Hz). 5.98 (1H. d. J=8Hz). 6.52 (1H. dd. J=8Hz.8Hz).
- 6. 80-7. 40 (11H)

実施例8

シス-N-(3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-6-クロロー3,4-ジヒドロ-4-メチルー2H-1,4-ベンズオキサジン<math>-8-カルボキサミド1-0gと1モル濃度のボランのテトラヒドロフラン溶液10m1を実施例

WO 93/09116 PCT/JP92/01426

5 と同様の製造法に付すことにより、シス-3-〔(6-クロロ-3, 4-ジヒドロ-4-メチル-2H-1, 4-ベンズオキサジン-8-イル)メチル〕アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン0.36gを得る。融点181~183℃NMR(CDC13,100MHz):

- 1.04-2.12 (7H). 2.44-2.90 (5H). 2.80 (3H. s). 3.00-3.20 (2H).
- 3.20-3.41 (2H). 3.66 (1H, dd, J=8Hz.12Hz). 3.99 (2H, dd, J=5Hz,6Hz),
- 4. 47 (1H, d, J=12Hz), 5. 89 (1H, d, J=3Hz), 6. 41 (1H, d, J=3Hz),
- 7.00-7.40 (10H)

実施例9

6-クロロ-2, 2-ジメチル-3, 4-ジヒドロ-4-メチル-2H-1, 4-ベンズオキサジン-8-カルボン酸 2. 81gと塩化ピバロイル 1. 34m 1、トリエチルアミン 1. 54m 1、シスー3-アミノー2-ベンズヒドリルキヌクリジン 2. 92gを用いて実施例 1と同じ製造法に付することにより、シスーN-(3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル) 1-6-クロロー 2, 2-ジメチルー 3, 4-ジヒドロー4-メチルー 2H-1, 4-ベンズオキサジンー8-カルボキサミド 2. 2gを得る。融点 254~ 256 $\mathbb C$

NMR (CDC1 $_3$, 100MHz):

- 1.20-2.10 (5H), 1.48 (3H. s), 1.73 (3H. s), 2.64-3.00 (4H),
- 2.98 (3H, s), 3.16 (2H, m), 4.06 (2H, m), 4.50 (2H, m),
- 6. 66 (1H, d, J=2Hz), 6. 90-7. 30 (11H), 8. 21 (1H, d, J=10Hz)

元素分析: C32H37C1N3O2 として

計算值: C 72.37. H 7.02. N 7.91

実測値: C 72.06, H 7.11, N 7.83

実施例10

5-メチルチオー2, 3-ジヒドロベンゾフランー7-カルボン酸0. 84 g と塩化ピバロイル0. 48 m 1、トリエチルアミン0. 56 m 1、シスー3-アミノー2-ベンズヒドリルキヌクリジン1. 18 g を用いて実施例1 と同じ製造法に付することにより、シスーN- [3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]

-5-xチルチオー2, 3-ジヒドロベンゾフランー7-カルボキサミド1.14 gを得る。融点 $200\sim201$ ^{\odot}

NMR (CDC1 $_{3}$, 100MHz):

1.25-2.10 (5H), 2.45 (3H, s), 2.70-3.12 (4H), 3.32 (2H, t, J=8Hz).

3.80-4.28 (2H), 4.50 (1H, m), 4.88 (2H, m), 6.80-7.30 (11H),

7.52 (1H, d, J=2Hz), 7.90 (1H, d. J=10Hz)

元素分析: C₃₀H₃₂N₂O₂Sとして

計算值: C 74.35, H 6.66, N 5.78

実測値: C 73.78, H 6.83, N 5.68

実施例11

5-ベンジルチオー2, 3-ジヒドロベンゾフランー7-カルボン酸0. 94 gと塩化ピバロイル0. 40 m 1、トリエチルアミン0. 46 m 1、シスー3- アミノー2-ベンズヒドリルキヌクリジン0. 88 gを用いて実施例1と同じ製造法に付することにより、シスーN-(3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)) -5-ベンジルチオー2, 3-ジヒドロベンゾフランー7-カルボキサミド1. 14 gを得る。融点 $184\sim185$ $\mathbb C$

NMR (CDC1 $_{3}$, 100MHz):

- 1.25-2.10 (5H), 2.70-3.12 (4H), 3.90-4.24 (2H), 4.48 (1H, m),
- 4.88 (2H, m), 6.80-7.30 (16H), 7.66 (1H, d, J=2Hz).
- 7.86 (1H, d, J=10Hz)

実施例12

NMR (CDC1 $_3$, 100MHz):

1. 24 (6H, d, J=8Hz), 1. 40-2. 10 (5H), 2. 70-3. 44 (6H), 4. 08 (2H, m), 4. 50 (1H, m), 4. 89 (2H, m), 6. 80-7. 38 (11H), 7. 66 (1H, d, J=2Hz), 7. 87 (1H, d, J=10Hz)

元素分析: Cs2Hs6N2O2Sとして

計算值: C 74.96, H 7.08, N 5.46

実測値: C 75.07, H 7.16, N 5.45

実施例13

2、2-ジェチル-5-ェタンスルホニル-2、3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボン酸1. 35gとクロロ炭酸エチル0. 61m1、トリエチルアミン1. 4m1、シスー3-アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン1. 39gを用いて実施例1と同じ製造法に付することにより、シスーNー〔<math>3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕 -2、2-ジェチル-5-ェタンスルホニル-2、3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド1. 67gを得る。融点249~250℃

NMR (CDC1₃, 100MHz):

- 1.66 (3H, s), 1.90 (3H, s), 1.40-2.10 (5H), 2.70-3.10 (4H),
- 3.00 (3H. s), 3.23 (2H, m), 3.86-4.24 (2H), 4.50 (1H, m),
- 6.80-7.38 (11H), 7.66 (1H. d. J=2Hz), 7.87 (1H. d. J=10Hz)

元素分析: C32H36N2O2Sとして

計算值: C 74.96, H 7.08, N 5.46

実測値: C 75.07, H 7.16, N 5.45

実施例14

5-メタンスルホニルー 2、3-ジヒドロベンゾフランー7-カルボン酸 1. 0 g と 0 ロロ 炭酸エチル 0、5 4 m 1、トリエチルアミン 1. 2 m 1、シスー 3 -アミノー 2-ベンズヒドリルキヌクリジン 1. 1 7 g を 用いて実施例 1 と同じ製造法に付することにより、シスーNー (3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)1-5-メタンスルホニルー 2、3-ジヒドロベンゾフランー7-カルボキサミド 1. 6 5 g を 得る。融点 2 6 6 \sim 2 6 7 $\mathbb C$

NMR (CDC13, 100MHz):

1.30-2.10 (5H), 2.60-3.10 (4H), 3.00 (3H, s), 3.40 (2H, m),

3.86-4.14 (2H), 4.52 (1H, m), 5.00 (2H, m), 6.80-7.30 (10H),

7. 60-7. 84 (2H), 8. 14 (1H, d. J=2Hz)

元素分析: C₃₀H₃₂N₂O₄Sとして

計算值: C 69.74, H 6.24, N 5.42

実測値: C 69.58, H 6.50, N 5.38

実施例15

2, 2-iジメチルー5-iジメチルアミノー2, 3-iジヒドロベンゾフランー7-カルボン酸1. 40gとクロロ炭酸エチル0. 78m1、トリエチルアミン1. 7m1、シスー3-rミノー2-iベンズヒドリルキヌクリジン1. 61gを用いて実施例1と同じ製造法に付することにより、シスーN-(3-(2-i)ベンズヒドリルキヌクリジニル)1-2, 2-iジメチルー5-iジメチルアミノー2, 3-iジヒドロベンゾフランー1-i0ーカルボキサミド11. 15gを得る。融点12340ー2 150~

NMR (CDC1 $_3$, 100MHz):

1.66 (3H, s), 1.84 (3H, s), 1.40-2.10 (5H), 2.70-3.20 (4H),

2.84 (6H, s), 3.76-4.56 (3H), 6.75 (2H, d, J=2Hz).

6. 90-7.32 (11H). 8.24 (1H. d. J=10Hz)

元素分析: C33H39N3O2 として

計算值: C 77.77, H 7.71, N 8.24

実測値: C 77.96. H 7.87. N 8.15

実施例16

ズオキサジン-8-7ル)メチル〕アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン1.6 gを得る。融点166~167^{\circ}

NMR (CDC1 $_3$, 100MHz):

1.21 (3H, s), 1.24 (3H, s), 1.04-2.12 (8H), 2.44-2.90 (5H),

2.87 (3H, s), 3.00-3.40 (2H), 3.68 (1H, m), 4.46 (1H, d, J=12Hz),

5.74 (1H, d, J=3Hz), 6.43 (1H, d, J=3Hz), 7.00-7.40 (10H)

元素分析: C32H38C1N3Oとして

計算值: C 74.47, H 7.42, N 8.14

実測値: C 74.86, H 7.47, N 8.16

実施例17

シス-N- [3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)] - 5-メチルチオ - 2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド1.0 gと1モル濃度のボランのテトラヒドロフラン溶液 <math>20m1 を実施例 5 と同様の製造法に付すことにより、シス-3-[(5-メチルチオ-2,3-ジヒドロベンゾフラン-7- イル) メチル] アミノ-<math>2-ベンズヒドリルキヌクリジン0.55 gを得る。融点 $150\sim151$ $^{\circ}$

NMR (CDC 1_3 . 100MHz):

1.10-2.10 (5H), 2.40 (3H, s), 2.45-3.30 (8H), 3.30-3.80 (2H),

4, 20-4, 55 (3H), 6, 44 (1H, d, J=2Hz), 6, 90-7, 38 (11H)

元素分析: C30H34N2OSとして

計算値: C 76.56, H 7.28, N 5.95

実測値: C 76.27, H 7.29, N 5.91

実施例18

る。

NMR (CDC1s, 100MHz):

1.04-2.10 (5H), 2.40-3.08 (6H), 3.16 (1H, s), 3.28-3.80 (2H),

3.94 (1H. s). 4.28 (2H. t, J=8Hz). 4.46 (1H. d, J=12Hz).

6.49 (1H, d, J=2Hz), 6.96 (1H, d, J=2Hz), 7.00-7.12 (15H)

実施例19

NMR (CDC1₃, 100MHz):

1.21 (6H, d, J=7Hz), 1.30-2.10 (6H). 2.40-3.30 (9H).

3.30-3.80 (2H), 4.20-4.56 (3H), 6.62 (1H, d, J=2Hz),

6. 90-8. 38 (11H)

元素分析:C32H38N2OSとして

計算值: C 77.07, H 7.68, N 5.62

実測値: C 77.08, H 7.73, N 5.56

実施例20

シスーNー〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕 -2, 2-ジメチルー5-メタンスルホニルー2, 3-ジヒドロベンゾフランー7-カルボキサミド1. <math>48gと1モル濃度のボランのテトラヒドロフラン溶液 30m1を実施例 5と同様の製造法に付すことにより、シスー3-〔(2,2-ジメチルー5-メタンスルホニルー2,3-ジヒドロベンゾフランー7ーイル)メチル〕アミノー2ーベンズヒドリルキヌクリジン<math>0.54gを得る。融点 $162\sim164$ $\mathbb C$ NMR(CDC13,100MHz):

1.44 (6H, d, J=4Hz), 1.00-2.08 (6H), 2.40-3.40 (9H), 3.00 (3H, m),

3.70 (1H. m), 4.48 (1H, d, J=12Hz), 7.00-7.60 (12H)

元素分析: C32H38N2O3Sとして

計算值: C 72.42, H 7.22. N 5.28

実測値: C 72.45, H 7.31, N 5.19

実施例21

シスーNー〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕 -5-メタンスルホニル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド1.54gと1モル濃度のボランのテトラヒドロフラン溶液 <math>30m1を実施例 5と同様の製造法に付すことにより、シスー3-((5-メタンスルホニル-2,3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル〕アミノー2-ベンズヒドリルキヌクリジン0.12gを得る。融点 194~196 $\mathbb C$

NMR (CDC1 $_3$, 100MHz):

1.00-2.08 (6H), 2.40-3.28 (8H), 3.00 (3H, m), 3.49 (1H, m),

3.68 (1H. m), 4.30-4.60 (3H), 7.00-7.60 (12H)

元素分析: C₃₂H₃₄N₂O₃Sとして

計算值: C 71.69, H 6.82, N 5.57

実測値: C 71.70, H 6.84, N 5.53

実施例22

シスーNー〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕-2, 2-ジメチルー5-ジメチルアミノー2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド1. 02gと1モル濃度のボランのテトラヒドロフラン溶液30m1を実施例5と同様の製造法に付すことにより、シスー<math>3-〔(2,2-ジメチル-5-ジメチルアミノ-2,3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル〕アミノー2ーベンズヒドリルキヌクリジン0.50gを得る。融点<math>147~148℃

NMR (CDC1 $_3$, 100MHz):

- 1.30 (6H, d, J=4Hz), 1.00-2.08 (6H), 2.40-3.40 (9H), 2.68 (6H, s),
- 3.00 (3H, m), 3.70 (1H, m), 4.48 (1H, d, J=12Hz), 5.85 (1H, m),
- 6.46 (1H, m), 6.90-7.50 (10H)

元素分析: CssHanNsOSとして

計算值: C 79.96, H 8.34, N 8.48

実測値: C 79.65, H 8.34, N 8.43

実施例23

5-アセトアミドー2, 2-ジメチルー2, 3-ジヒドロベンゾフランー7ー カルボン酸メチルエステル2. 4gをエタノール30m1とテトラヒドロフラン 20mlの混合溶媒に溶解させる。続いて臭化リチウム1水和物2.09gと水 素化ホウ素ナトリウム 0. 76 gを加え、6時間還流させる。次に溶媒を濃縮除 去し残渣を酢酸エチルと水に分配させ、酢酸エチル層を飽和炭酸水素ナトリウム 水溶液と飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させる。硫酸マグネシウ ムと溶媒を除去し残渣をシリカゲルクロマトにより精製して、5-アセトアミド 5gを得る。かくして得られる5ーアセトアミドー2,2ージメチルー7ーヒド ロキシメチルー 2, 3 - ジヒドロベンゾフラン1.5 gをジクロロエタン 25 m1に溶解させ氷冷下、塩化チオニル0.6m1を加え2時間撹拌する。次に反応 液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液と飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで 乾燥させる。硫酸マグネシウムと溶媒を除去し残渣にノルマルヘキサンを加えて 結晶化させることにより、5-アセトアミド-7-クロロメチル-2, 2-ジメ チルー2, 3-ジヒドロベンゾフラン1. 45gを得る。融点164~165°C 5-アセトアミド-7-クロロメチル-2, 2-ジメチル-2, 3-ジヒドロ ベンゾフラン0.51g、シスー3-アミノー2-ベンズヒドリルキヌクリジン 0.59gをジメチルホルムアミド10m1に溶解させ、炭酸カリウム0.55 gを加えて一昼夜室温にて撹拌する。反応液を水とクロロホルムに分配させ、ク ロロホルム層を濃縮後シリカゲルカラムクロマトにて精製することにより、シス ンー7-イル)メチル〕アミノー2-ベンズヒドリルキヌクリジン0.23gを 得る。

実施例 2 4

バイオオーガニック・アンド・メディシナル・ケミストリー・レターズ(Bio-organic & Medicinal Chemistry Letters) Vol.1、No.2、pp 129-132に記載の方法にて合成される(一)-3-アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン30 mg と5-メチルチオー2、3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボン酸32 mg、トリエチルアミン0.042 m1、クロロ炭酸エチル0.016 m1 を用いて実施例1 と同様の製造法に付することにより、(一)-シス-N-[3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-5-メチルチオー2、3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド40 mgを得る。かくして得られるアミド体を1 モル 濃度のボランのテトラヒドロフラン溶液3 m1 を用いて実施例5 と同じ製造法に付し、シリカゲルクロマトグラフィーにて精製することにより、(一)-シス-3-[(5-メチルチオー2、3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル]アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン4 mgを得る。

製剤例

次に、本発明の医薬の製剤例をあげる。

(1) 錠剤

上記化合物(I)を0.5部、乳糖25部、結晶セルロース35部およびコーンスターチ3部とをよく混和したのち、コーンスターチ2部で製した結合剤とよく練合する。この練合物を16メッシュで篩過し、オーブン中50℃で乾燥後、24メッシュで篩過する。ここに得た練合粉体とコーンスターチ8部、結晶セルロース11部およびタルク9部とをよく混合した後、圧搾打錠し、1錠当たり有効成分0.5mg含有の錠剤を得る。

(2) 1%散剂

上記の化合物(I)を1部と乳糖90部をよく混和し、適当量のメチルセルロースより製した結合剤とよく練合する。これを16メッシュで篩過し、オープン中50℃で乾燥する。乾燥顆粒末を32メッシュで圧篩過し、適量のシリコンジオキシドとよく混和して、1%散剤を得る。

請求の範囲

1. 一般式(I):

$$R^{1} \xrightarrow{A} X$$

$$R^{2}$$

$$R^{2}$$

$$R^{3}$$

$$R^{4} \xrightarrow{NH} R^{6}$$

$$R^{5}$$

〔式中、Aはメチレン基、酸素原子、硫黄原子、-N(R7)-で表される基(式中、R7 は水素、炭素数 $1\sim 6$ 個のアルキルまたはアラルキルを示す。)または直接結合を示す。XおよびYは同一または異なって酸素原子、硫黄原子または水素 2 原子を示す。R1 は水素、ハロゲン、炭素数 $1\sim 6$ 個のアルキル、ハロアルキル、アラルキル、炭素数 $1\sim 6$ 個のアルコキシ、アラルキルオキシ、アリールオキシ、アシル、アシルオキシ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、シアノまたは式

- $-NHCOR^*$, $-S(O)_nR^*$, $-NHSO_2R^*$, $-COOR^*$,
- $-N(R^{8})(R^{9}), -CON(R^{8})(R^{9}), -O-CO-N(R^{8})(R^{9}),$
- $-O-CS-N(R^{8})(R^{9}), -SO_{2}N(R^{8})(R^{9})$

(式中、 R^8 , R^8 は同一または異なってそれぞれ水素、炭素数 $1 \sim 6$ 個のアルキル、フェニルまたはアラルキルを示し、n は 0, 1 または 2 を示す。)から選ばれる基を示す。 R^2 , R^3 は同一または異なって水素または炭素数 $1 \sim 6$ 個のアルキルを示す。 R^4 は水素または炭素数 $1 \sim 6$ 個のアルキルを示す。 R^5 はチエニルまたはフェニルを示す。 R^6 は炭素数 $1 \sim 6$ 個のアルキル、炭素数 $2 \sim 6$ 個のアルケニル、炭素数 $3 \sim 7$ 個のシクロアルキル、フリル、チエニル、ピリジル、インドリル、ビフェニルまたはフェニルを示す。ただし、A が酸素原子、かつX およびY が共に水素 2 原子、かつ R^1 が水素、かつ R^2 , R^3 が共に水素である場合、およびA が直接結合、かつX およびY が共に水素 2 原子、かつ R^1

が水素、かつ R^2 , R^3 が共に水素である場合を除く。〕 により表されるキヌクリジン化合物またはその医薬上許容されうる酸付加塩。

- 2. Aが $-N(CH_s)$ -または直接結合を示し、XおよびYが同一または異なって酸素原子または水素 2 原子を示し、 R^2 , R^3 が共に水素または共にメチルを示し、 R^4 が水素を示し、 R^5 , R^6 が共にフェニルであることを特徴とする請求の範囲第1項記載のキヌクリジン化合物またはその医薬上許容されうる酸付加塩。ただし、Aが直接結合、かつXおよびYが共に水素 2 原子、かつ R^1 が水素、かつ R^2 , R^3 が共に水素である場合を除く。
- 3. シス-N-[3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-6-クロロー 3, 4-ジヒドロー4-メチルー2H-1, 4-ベンズオキサジンー8-カルボ キサミド、シス-N-(3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル))-2,2-ジメチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、シス-N-[3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-2,2-ジメチルー5-メチ ルチオー2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、シス-N-〔3 - (2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-2,2-ジメチル-5-ニトロー 2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、シス-3-〔(2, 2-ジメチルー5-ニトロー2, 3-ジヒドロベンゾフランー7-イル)メチル]ア ミノー2ーベンズヒドリルキヌクリジン、シスー3ー〔(2,2ージメチルー5 ーメチルチオー2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル)アミノ-2 ーベンズヒドリルキヌクリジン、シスー3ー〔(2,2-ジメチルー2,3-ジ ヒドロベンゾフラン-7-イル) メチル] アミノー2-ベンズヒドリルキヌクリ ジン、シスー3ー〔(6ークロロー3, 4ージヒドロー4ーメチルー2H-1, 4-ベンズオキサジン-8-イル)メチル]アミノ-2-ベンズヒドリルキヌク リジン、シス-N-〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕-6-クロ ロー2, 2-ジメチルー3, 4-ジヒドロー4-メチルー2H-1, 4-ベンズ オキサジン-8-カルボキサミド、シス-N-〔3-〔2-ベンズヒドリルキヌ クリジニル)] -5-メチルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボ キサミド、シス-N- (3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-5-ベ

ンジルチオー2.3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、シスーN-(3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル))-5-イソプロピルチオー2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、シス-N-〔3-〔2-ベン ズヒドリルキヌクリジニル)] - 2, 2 - ジメチル - 5 - メタンスルホニル - 2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、シス-N-〔3-〔2-ベン ズヒドリルキヌクリジニル)〕-5-メタンスルホニル-2、3-ジヒドロベン ゾフラン-7-カルボキサミド、シス-N-〔3-〔2-ベンズヒドリルキヌク リジニル) 1 - 2. 2 - ジメチル - 5 - ジメチルアミノ - 2. 3 - ジヒドロベンプフラン-7-カルボキサミド、シス-3-〔(6-クロロ-3.4-ジヒドロ -2, 2-ジメチル-4-メチル-2H-1, 4-ベンズオキサジン-8-イル) メチル] アミノー2ーベンズヒドリルキヌクリジン、シスー3ー〔(5ーメチル チオー2. 3ージヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル]アミノー2-ベンズ ヒドリルキヌクリジン、シスー3-〔(5-ベンジルチオー2,3-ジヒドロベ ンプフランー7ーイル)メチル)アミノー2ーベンズヒドリルキヌクリジン、シ スー3- ((5-イソプロピルチオー2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル) メチル〕アミノー2-ベンズヒドリルキヌクリジン、シスー3-〔(2,2-ジ メチルー5ーメタンスルホニルー2、3ージヒドロベンブフランー7ーイル)メ チル) アミノー2ーベンズヒドリルキヌクリジン、シスー3ー〔(5ーメタンス ルホニルー2、3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル〕アミノー2-ベ ンズヒドリルキヌクリジン、シスー3-〔(2,2-ジメチルー5-ジメチルア ミノー2,3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル〕アミノー2-ベンズ ヒドリルキヌクリジン、シスー3-〔(5-アセトアミドー2,2-ジメチルー 2. 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル]アミノ-2-ベンズヒドリ ルキヌクリジン、および(-) -シス-3-〔(5-メチルチオ-2, 3-ジヒ ドロベンゾフラン-7-イル)メチル)アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジ ンから選ばれる請求の範囲第1項または第2項記載のキヌクリジン化合物または その医薬上許容されうる酸付加塩。

4. 請求の範囲第1項ないし第3項のいずれかに記載の化合物の治療上有効量と、

医薬上許容されうる添加剤からなる医薬組成物。

- 5. 請求の範囲第1項ないし第3項のいずれかに記載の化合物を有効成分として合有することを特徴とする鎮痛抗炎症薬。
- 6. 請求の範囲第1項ないし第3項のいずれかに記載の化合物を有効成分として 含有することを特徴とする咳、喀痰を伴う慢性気管支炎、喘息、鼻炎などの呼吸 器系疾患の治療薬。
- 7. 請求の範囲第1項ないし第3項のいずれかに記載の化合物を有効成分として含有することを特徴とする不安症、精神病などの中枢神経系疾患の治療薬。
- 8. 請求の範囲第1項ないし第3項のいずれかに記載の化合物を有効成分として含有することを特徴とする高血圧症、心不全などの循環器系疾患の治療薬。
- 9. 請求の範囲第1項ないし第3項のいずれかに記載の化合物を有効成分として 含有することを特徴とする過敏性大腸炎、潰瘍性大腸炎、クローン病などの消化 器系疾患の治療薬。

10. 一般式(I'):

$$R^{1} \xrightarrow{A} X$$

$$R^{2}$$

$$R^{4} \xrightarrow{NH} R^{6}$$

$$R^{5}$$

$$R^{5}$$

〔式中、Aはメチレン基、酸素原子、硫黄原子、-N(R7)-で表される基(式中、R7 は水素、炭素数 $1\sim 6$ 個のアルキルまたはアラルキルを示す。)または直接結合を示す。Xは酸素原子、硫黄原子または水素 2 原子を示す。R1 は水素、ハロゲン、炭素数 $1\sim 6$ 個のアルキル、ハロアルキル、アラルキル、炭素数 $1\sim 6$ 個のアルコキシ、アラルキルオキシ、アリールオキシ、アシル、アシルオキシ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、シアノまたは式

- $-NHCOR^{8}$, $-S(O)_{2}R^{8}$, $-NHSO_{2}R^{8}$, $-COOR^{8}$,
- $-N(R^{8})(R^{9}), -CON(R^{9})(R^{9}), -O-CO-N(R^{9})(R^{9}),$
- $-O-CS-N(R^{8})(R^{9}), -SO_{2}N(R^{8})(R^{9})$

(式中、 R^8 , R^8 は同一または異なってそれぞれ水素、炭素数 $1 \sim 6$ 個のアルキル、フェニルまたはアラルキルを示し、n は 0, 1 または 2 を示す。)から選ばれる基を示す。 R^2 , R^3 は同一または異なって水素または炭素数 $1 \sim 6$ 個のアルキルを示す。 R^4 は水素または炭素数 $1 \sim 6$ 個のアルキルを示す。 R^5 はチエニルまたはフェニルを示す。 R^6 は炭素数 $1 \sim 6$ 個のアルキル、炭素数 $2 \sim 6$ 個のアルケニル、炭素数 $3 \sim 7$ 個のシクロアルキル、フリル、チエニル、ピリジル、インドリル、ビフェニルまたはフェニルを示す。〕により表されるキヌクリジン化合物またはその医薬上許容されうる酸付加塩。

補正された 請求の範囲

[1993年4月5日(05.04.93)国際事務局受理;出願当初の請求の範囲1,2 及び10は補正された;他の請求の範囲は変更なし。(5頁)]

1. (補正後) 一般式(I):

$$R^{1} \xrightarrow{A} X$$

$$R^{2}$$

$$R^{2}$$

$$R^{3}$$

$$R^{4} \xrightarrow{NH} R^{6}$$

$$R^{5}$$

〔式中、Aはメチレン基、酸素原子、硫黄原子、-N(R7)-で表される基(式中、R7 は水素、炭素数 1 ~ 6 個のアルキルまたはアラルキルを示す。)または直接結合を示す。X およびYは同一または異なって酸素原子、硫黄原子または水素 2 原子を示す。R1 は水素、ハロゲン、炭素数 1 ~ 6 個のアルキル、ハロアルキル、アラルキル、炭素数 1 ~ 6 個のアルコキシ、アラルキルオキシ、アリールオキシ、アシル、アシルオキシ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、シアノまたは式

- $-NHCOR^{*}$, $-S(O)_{n}R^{*}$, $-NHSO_{2}R^{*}$, $-COOR^{*}$,
- $-N(R^{s})(R^{s}), -CON(R^{s})(R^{s}), -O-CO-N(R^{s})(R^{s}),$
- $-O-CS-N(R^{8})(R^{9}), -SO_{2}N(R^{8})(R^{9})$

(式中、 R^8 , R^9 は同一または異なってそれぞれ水素、炭素数 $1 \sim 6$ 個のアルキル、フェニルまたはアラルキルを示し、n は 0, 1 または 2 を示す。)から選ばれる基を示す。 R^2 , R^3 は同一または異なって水素または炭素数 $1 \sim 6$ 個のアルキルを示す。 R^4 は水素または炭素数 $1 \sim 6$ 個のアルキルを示す。 R^5 はチエニルまたはフェニルを示す。 R^6 は炭素数 $1 \sim 6$ 個のアルキル、炭素数 $2 \sim 6$ 個のアルケニル、炭素数 $3 \sim 7$ 個のシクロアルキル、フリル、チエニル、ピリジル、インドリル、ビフェニルまたはフェニルを示す。ただし、A が酸素原子、かつX が水素 2 原子、Y が酸素原子または水素 2 原子、かつX が水素 2 原子、X が共に水素である場合、およびX が直接結合、かつX が水素 2 原子、X が共に水素である場合、およびX が直接結合、かつX が水素 2 原子、X が数

素原子または水素 2 原子、かつ R^1 が水素、かつ R^2 , R^3 が共に水素である場合を除く。〕

により表されるキヌクリジン化合物またはその医薬上許容されうる酸付加塩。

2. (補正後) Aが-N(CH_3)-または直接結合を示し、XおよびYが同一ま たは異なって酸素原子または水素2原子を示し、R², R³が共に水素または共 にメチルを示し、R4 が水素を示し、R5, R6 が共にフェニルであることを特 令とする請求の範囲第1項記載のキョクリジン化合物またはその医薬上許容され うる酸付加塩。ただし、Aが直接結合、かつXが水素2原子、Yが酸素原子また は水素 2 原子、かつ R^1 が水素、かつ R^2 , R^3 が共に水素である場合を除く。 3. シス-N-(3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル))-6-クロロー 3, 4-ジヒドロー4-メチルー2H-1, 4-ベンズオキサジンー8-カルボ **- キサミド、シス−N−〔3−(2−ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕−2, 2** ージメチルー2.3ージヒドロベンゾフランー7ーカルボキサミド、シスーNー [3-(2-x)]ルチオー 2、 3 ージヒドロベンゾフランー 7 ーカルボキサミド、シスーN-〔3 - (2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-2,2-ジメチル-5-ニトロー 2, 3-ジヒドロベンプフラン-7-カルボキサミド、シス-3-〔(2.2-ジメチルー5-ニトロー2,3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル〕ア ミノー2-ベンズヒドリルキヌクリジン、シス-3-〔(2,2-ジメチル-5 -メチルチオー2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル〕アミノー2 ーベンズヒドリルキヌクリジン、シスー3ー〔(2,2ージメチルー2,3ージ ヒドロベンゾフランー7ーイル)メチル〕アミノー2-ベンズヒドリルキヌクリ ジン、シス-3-((6-200-3, 4-3))ヒドロ-4-3チル-2H-14-ベンズオキサジン-8-イル)メチル]アミノ-2-ベンズヒドリルキヌク リジン、シス-N-(3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル))-6-クロオキサジン-8-カルボキサミド、シス-N-〔3-〔2-ベンズヒドリルキヌ クリジニル)] -5-メチルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボ

WO 93/09116 PCT/JP92/01426

キサミド、シス-N- (3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-5-ベ

医薬上許容されうる添加剤からなる医薬組成物。

- 5. 請求の範囲第1項ないし第3項のいずれかに記載の化合物を有効成分として 含有することを特徴とする鎮痛抗炎症薬。
- 6. 請求の範囲第1項ないし第3項のいずれかに記載の化合物を有効成分として 含有することを特徴とする咳、喀痰を伴う慢性気管支炎、喘息、鼻炎などの呼吸 器系疾患の治療薬。
- 7. 請求の範囲第1項ないし第3項のいずれかに記載の化合物を有効成分として含有することを特徴とする不安症、精神病などの中枢神経系疾患の治療薬。
- 8. 請求の範囲第1項ないし第3項のいずれかに記載の化合物を有効成分として 含有することを特徴とする高血圧症、心不全などの循環器系疾患の治療薬。
- 9. 請求の範囲第1項ないし第3項のいずれかに記載の化合物を有効成分として 含有することを特徴とする過敏性大腸炎、潰瘍性大腸炎、クローン病などの消化 器系疾患の治療薬。
- 10. (補正後) 一般式(I'):

$$R^{1} \xrightarrow{A} X$$

$$R^{2}$$

$$R^{4} \xrightarrow{NH} R^{6}$$

$$R^{5}$$

$$R^{5}$$

(式中、Aはメチレン基、酸素原子、硫黄原子、-N(R?)-で表される基(式中、R? は水素、炭素数 $1\sim 6$ 個のアルキルまたはアラルキルを示す。)または直接結合を示す。Xは酸素原子、硫黄原子または水素 2 原子を示す。R! は水素、ハロゲン、炭素数 $1\sim 6$ 個のアルキル、ハロアルキル、アラルキル、炭素数 $1\sim 6$ 個のアルコキシ、アラルキルオキシ、アリールオキシ、アシル、アシルオキシ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、シアノまたは式

- $-NHCOR^{s}$, $-S(O)_{n}R^{s}$, $-NHSO_{2}R^{s}$, $-COOR^{s}$,
- $-N(R^{s})(R^{s}), -CON(R^{s})(R^{s}), -O-CO-N(R^{s})(R^{s}),$
- $-0-CS-N(R^{8})(R^{9}), -SO_{2}N(R^{8})(R^{9})$

(式中、R 8 , R 8 は同一または異なってそれぞれ水素、炭素数 $1\sim 6$ 個のアルキル、フェニルまたはアラルキルを示し、n は 0, 1 または 2 を示す。)から選ばれる基を示す。R 2 , R 3 は同一または異なって水素または炭素数 $1\sim 6$ 個のアルキルを示す。R 4 は水素または炭素数 $1\sim 6$ 個のアルキルを示す。R 5 はチエニルまたはフェニルを示す。R 6 は炭素数 $1\sim 6$ 個のアルキル、炭素数 $2\sim 6$ 個のアルケニル、炭素数 $3\sim 7$ 個のシクロアルキル、フリル、チエニル、ピリジル、インドリル、ビフェニルまたはフェニルを示す。ただし、Aが酸素原子、かつXが水素 2 原子、かつR 1 が水素、かつR 2 , R 3 が共に水素 2 原子である場合、およびAが直接結合、かつXが水素 2 原子、かつR 1 が水素、かつR 2 , R 3 が共に水素 2 原子である場合、およびAが直接結合、かつXが水素 2 原子、かつR 1 が水素、かつR 2 , R 3 が共に水素 2 原子である場合を除く。】

により表されるキヌクリジン化合物またはその医薬上許容されうる酸付加塩。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP92/01426

A. CLA	SSIFICATION OF SUBJECT MATTER				
Int.	C1 ⁵ C07D453/02, A61K31/43	5, 31/44, 31/535			
	to International Patent Classification (IPC) or to both	national classification and IPC			
	LDS SEARCHED				
1	Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)				
	Int. Cl ⁵ C07D453/02, A61K31/435-31/44, 31/535				
Documentat	Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched				
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) CAS ONLINE					
C. DOCU	MENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT				
Category*	Citation of document, with indication, where a	ppropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.		
X Y	JP, A, 3-503768 (Pfizer II August 22, 1991 (22. 08. 9 Claim & WO, A1, 90/05525 & EP, A, 409931 & US, A, 9	91),	10 1-9		
Further documents are listed in the continuation of Box C. See patent family annex.					
* Special categories of cited documents: "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "I" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention					
"I." docume	"E" earlier document but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other				
"O" docume means	special reason (as specified) "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art				
	P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "&" document member of the same patent family				
	Date of the actual completion of the international search January 14, 1993 (14. 01. 93) Date of mailing of the international search report February 9, 1993 (09. 02. 93)				
Name and m	Name and mailing address of the ISA/ Authorized officer				
Japan	Japanese Patent Office				
Facsimile No	Facsimile No. Telephone No.				

A. 発明の属する分野の分類(国際特許分類(IPC))

Int. CL

C07D453/02, A61K31/435,31/44,31/535

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料(国際特許分類(IPC))

Int. CL5

C07D453/02. A61K31/435-31/44,31/535

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース(データベースの名称、調査に使用した用語)

CAS ONLINE

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X Y	JP,A,3-503768 (Pfizer Inc.) 22.8月.1991 (22.08.91), 特許請求の範囲をWO,A1,90/05525 &EP,A,409931&US,A,5162339	1 0 1 - 9

□ C棚の続きにも文献が列挙されている。

□ パテントファミリーに関する別紙を参照。

- * 引用文献のカテゴリー
- 「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
- 「E」先行文献ではあるが、国際出願日以後に公表されたもの
- 「L」優先権主張に疑惑を提起する文献又は他の文献の発行日 若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)
- 「〇」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
- 「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願の日 の後に公表された文献
- 「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と 矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のため に引用するもの
- 「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規 性又は進歩性がないと考えられるもの
- 「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
- 「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

14.01.93

国際調査報告の発送日

09.02.93

名称及びあて先

£

4

日本国特許庁(ISA/JP)

郵便番号100

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官(権限のある職員)

大 宅 郁 治

4 C 8 8 2 9

電話番号 03-3581-1101 内線

3 4 5 2